



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẢNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

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

(11)



1-0035408

(51)¹⁹ A01N 43/40; A01N 43/54; A01N 43/56; (13) B
A01N 43/58; A01N 43/60; A01N
43/653; A01N 43/78; A01N 43/80;
A01N 43/84; A01P 3/00; C07D 213/30;
C07D 213/81; C07D 401/06; C07D
401/12; C07D 405/12; C07D 409/12;
C07D 413/04; C07D 413/12; C07D
417/06; C07D 417/12; A01N 43/52

(21) 1-2019-05636

(22) 16/03/2018

(86) PCT/JP2018/010408 16/03/2018

(87) WO/2018/169038 20/09/2018

(30) 2017-052072 17/03/2017 JP; 2017-216236 09/11/2017 JP

(45) 25/04/2023 421

(43) 30/01/2020 382A

(73) MMAG Co., Ltd. (JP)

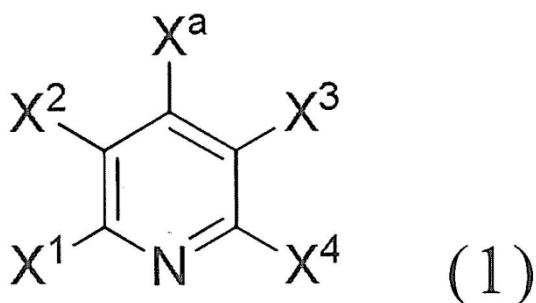
1-19-1, Nihonbashi, Chuo-ku, Tokyo, 1030027, Japan

(72) KAGABU Shinzo (JP); YAMAMOTO Kentaro (JP); OHNO Ikuya (JP); NAGATA Hirotaka (JP); TAKIGUCHI Yukiko (JP); UMEMURA Kenji (JP); MITOMI Masaaki (JP).

(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) CHẤT KIỂM SOÁT BỆNH Ở THỰC VẬT VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT BỆNH Ở THỰC VẬT

(57) Sáng chế đề cập đến chất kiểm soát bệnh ở thực vật mà chứa hợp chất được biểu diễn bởi công thức (1) làm thành phần hoạt tính.



Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến chất kiểm soát bệnh ở thực vật. Cụ thể hơn, sáng chế đề cập đến chất kiểm soát bệnh ở thực vật, hợp chất mới, và phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật. Sáng chế yêu cầu quyền ưu tiên trên cơ sở đơn sáng chế Nhật Bản số 2017-052072 được nộp ở Nhật Bản vào ngày 17 tháng ba năm 2017, và đơn sáng chế Nhật Bản số 2017-216236 được nộp ở Nhật Bản vào ngày 9 tháng mười một, 2017, nội dung của các đơn nêu trên được kết hợp vào sáng chế bằng cách viện dẫn.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Thực vật đã tiến hóa và có được các cơ chế kháng bệnh vật lý và hóa học chống lại các mầm gây bệnh bên ngoài. Cơ chế kháng bệnh vật lý là, ví dụ, phủ, như lớp sáp hoặc lớp biểu bì, hoặc thành tế bào, mà đóng vai trò là lớp chắn thâm nhập chống lại các mầm gây bệnh. Mặt khác, cơ chế kháng bệnh hóa học là hệ thống mà ức chế sự phát triển của vi khuẩn gây bệnh, như yếu tố kháng bệnh vốn đã có trong thực vật, hoặc yếu tố kháng bệnh được tổng hợp sinh học và được tích lũy ở trong thực vật.

Hiện nay, để bảo vệ thực vật khỏi bệnh, tác nhân bên ngoài đã được quản lý để kích hoạt cơ chế kháng bệnh hóa học để cải thiện sức chịu đựng của thực vật. Tác nhân như này có thể được gọi là chất gây cảm ứng kháng bệnh, và các chất gây cảm ứng khác nhau đã được thử nghiệm cho đến nay. Điều đã được biết là việc kháng lại virus gây bệnh khảm thuốc lá (TMV) được cảm ứng bằng cách xử lý thuốc lá với axit salixylic hoặc axit axetylsalixylic, (xem tài liệu phi sáng chế 1).

Do đó, đối với việc trồng thực vật khỏe mạnh và đảm bảo an toàn thực phẩm, điều rất hữu dụng khi tạo ra sức đề kháng cho thực vật để bảo vệ

thực vật khỏi nhiễm các mầm gây bệnh cho thực vật hoặc vi khuẩn gây bệnh cho thực vật.

Các dẫn xuất axit isonicotinic được thể clo có hiệu quả kiểm soát bệnh của thực vật đã được bộc lộ (Các tài liệu sáng chế từ 1 đến 5). Tuy nhiên, cần phải biết là các hợp chất như này có thể gây ra tổn hại hoặc hiệu quả kiểm soát bệnh của thực vật các hợp chất này yếu. Ngoài ra, đối với các dẫn xuất axit isonicotinic được thể flo, chất kiểm soát các bệnh ở thực vật tương tự đã được bộc lộ (các tài liệu sáng chế 6 đến 10), nhưng không có mô tả cụ thể liên quan đến chất kiểm soát bệnh ở thực vật trồng theo sáng chế.

Danh sách tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Sho 63-93766

Tài liệu sáng chế 2: Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 1-283270

Tài liệu sáng chế 3: Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 9-165374

Tài liệu sáng chế 4: Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 10-95772

Tài liệu sáng chế 5: Công bố đơn sáng chế quốc tế số 2005-68430

Tài liệu sáng chế 6: Công bố đơn sáng chế quốc tế số 2008-098928

Tài liệu sáng chế 7: Công bố đơn sáng chế quốc tế số 96-03047

Tài liệu sáng chế 8: Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 1-272569

Tài liệu sáng chế 9: Công bố đơn sáng chế quốc tế số 2009-11305

Tài liệu sáng chế 10: Công bố đơn sáng chế quốc tế số 2014-124988

Tài liệu phi sáng chế

Tài liệu phi sáng chế 1: R.F.White, Acetylsalicylic acid (aspirin) induces resistance to tobacco mosaic virus in tobacco, Virology, 99, 410 (1979)

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Giải quyết vấn đề

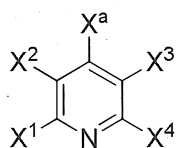
Sáng chế đề xuất chất kiểm soát bệnh ở thực vật trồng, hợp chất mới mà làm giảm tổn hại đến thực vật, và phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật.

Cách thức giải quyết vấn đề

Nhờ các nghiên cứu chuyên sâu liên quan đến hợp chất pyridin được thế flo, các tác giả sáng chế phát hiện ra rằng có các hợp chất mà thể hiện các hoạt tính gây cảm ứng kháng bệnh cao trong khi làm giảm tổn hại mà không thể hiện các hoạt tính kháng vi sinh vật trực tiếp chống lại các mầm gây bệnh cho thực vật, và từ đó hoàn thành sáng chế.

Sáng chế bao gồm các khía cạnh sau.

[1] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật chứa hợp chất có công thức (1) làm thành phần hoạt tính.

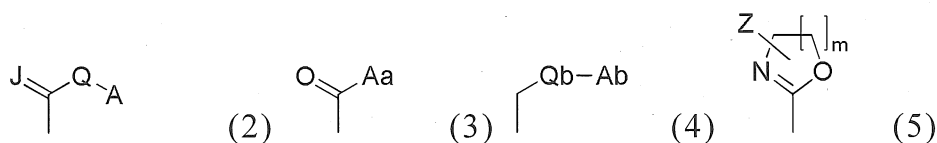


(1)

[Trong công thức (1), X^1 và X^4 là giống nhau hoặc khác nhau, là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl, ít

nhất một trong X^1 và X^4 là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl, X^2 và X^3 giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm metyl, và, khi một trong X^1 , X^2 và X^4 là nguyên tử flo, ký hiệu bất kỳ trong hai ký hiệu còn lại của công thức này không là nguyên tử hydro,

X^a là nhóm có công thức (2), (3), (4) hoặc (5),



trong công thức (2), J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

A là:

nhóm alkyl C1-12 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm thiol, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino,

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm

được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy,

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

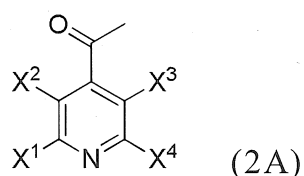
nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl,

nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphthyl,

nhóm naphthyl,

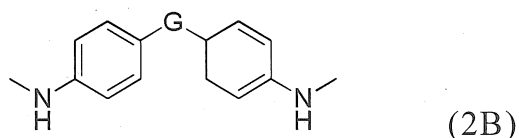
nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây), hoặc

nhóm công thức (2A) [trong công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)],



trong đó, khi A là nhóm có công thức (2A), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-NH-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylodioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-$, nhóm 1,3-phenylldiamino, nhóm 1,4-phenylldiamino, nhóm 1,4-phenylldioxy, nhóm công thức hóa trị

hai: -NH-(1,4-phenylen)-O-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B) [trong công thức (2B), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -SO₂-] (mà trong đó n là số nguyên từ 2 đến 8), và



khi A không là nhóm có công thức (2A), Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

trong công thức (3), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm 1-metyl-1-1H-pyrol-2-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm indolin-1-yl, nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxit-2-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl,

trong công thức (4), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

Ab là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nguyên tử hydro, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm phenylcacbonyl, hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây),

trong công thức (5), m là số nguyên từ 1 đến 3, Z là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm methyl,

nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-methyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, nhóm phenylcacbonyl, các nhóm pyridyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm methylthio, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkylcacbonyl C1-4, nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm benzylaminocacbonyl, nhóm axetoxy, nhóm nitro, và nhóm xyano, và

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm 2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl, nhóm dihydrothiazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm

benzothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, nhóm isothiazolyl, và nhóm triazolyl.]

[2] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục [1], trong đó X^1 , X^2 , X^3 và X^4 trong công thức (1) là các nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử flo.

[3] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục [1] hoặc [2], trong đó, trong công thức (1), X^1 và X^4 là các nguyên tử flo, và X^2 hoặc X^3 là nguyên tử hydro.

[4] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3], trong đó, trong công thức (1), X^1 và X^4 là các nguyên tử flo, và X^2 và X^3 là các nguyên tử hydro.

[5] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [4], trong đó J trong công thức (2) là nguyên tử oxy.

[6] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [5], trong đó Q trong công thức (2) là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.

[7] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [5], trong đó Q trong công thức (2) là nguyên tử oxy.

[8] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [7], trong đó A trong công thức (2) là:

nhóm alkyl C1-12 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

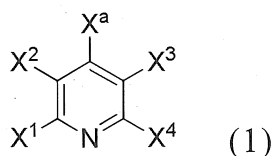
nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy;

nhóm phenylsulfony mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy và nhóm benzyl; hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E).

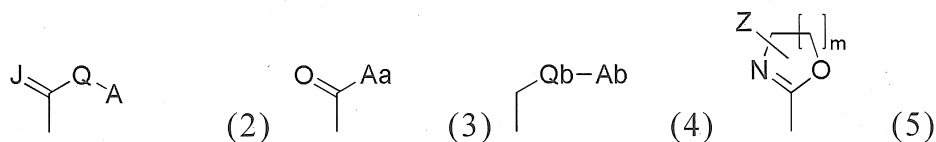
[9] Hợp chất của công thức (1) (ngoại trừ hợp chất có công thức (2) trong đó J và Q là các nguyên tử oxy, A là nhóm metyl, nhóm etyl hoặc nhóm xyclohexyl, hoặc hợp chất có công thức (2) trong đó J là nguyên tử oxy, Q là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-, và A là nhóm 3-clo-4-flophenyl),



[trong công thức (1), X¹ và X⁴ giống nhau hoặc khác nhau, là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl, ít nhất một trong X¹ và X⁴ là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl, X² và X³ giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc

nhóm metyl, và, khi một trong X^1 , X^2 và X^4 là nguyên tử flo, ký hiệu bất kỳ trong hai ký hiệu còn lại của công thức này không là nguyên tử hydro,

X^a là nhóm có công thức (2), (3), (4) hoặc (5),



trong công thức (2), J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

A là:

nhóm alkyl C1-12 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm thiol, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy,

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm

được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

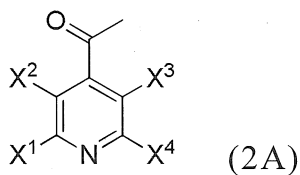
nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl,

nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl,

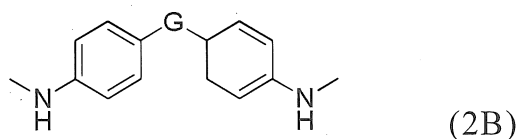
nhóm naphtyl,

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây), hoặc

nhóm công thức (2A) [trong công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)],



trong đó, khi A là nhóm có công thức (2A), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-NH-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-$, nhóm 1,3-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(1,4-phenylen)-O-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B) [trong công thức (2B), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-SO_2-$] (mà trong đó n là số nguyên từ 2 đến 8),



khi A không là nhóm có công thức (2A), Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

trong công thức (3), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl,

trong công thức (4), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

Ab là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây),

trong công thức (5), m là số nguyên từ 1 đến 3, Z là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm methyl,

Nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-methyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, nhóm phenylcarbonyl, các nhóm pyridyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm methylthio, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkylcarbonyl C1-4, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl, nhóm benzylaminocarbonyl, nhóm axetoxy, nhóm nitro, và nhóm xyano, và

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm 2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl, nhóm dihydrothiazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, nhóm isothiazolyl, và nhóm triazolyl.]

[10] Hợp chất theo mục [9], trong đó X^1 , X^2 , X^3 và X^4 trong công thức (1) là các nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử flo.

[11] Hợp chất theo mục [9] hoặc [10], trong đó, trong công thức (1), X^1

và X^4 là các nguyên tử flo, và X^2 hoặc X^3 là nguyên tử hydro.

[12] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [11], trong đó, trong công thức (1), X^1 và X^4 là các nguyên tử flo, và X^2 và X^3 là các nguyên tử hydro.

[13] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [12], trong đó J trong công thức (2) là nguyên tử oxy.

[14] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [13], trong đó Q trong công thức (2) là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.

[15] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [13], trong đó Q trong công thức (2) là nguyên tử oxy.

[16] Hợp chất theo mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [15], trong đó A trong công thức (2) là:

nhóm alkyl C1-12 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy;

nhóm phenylsulfony mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy và nhóm benzyl; hoặc

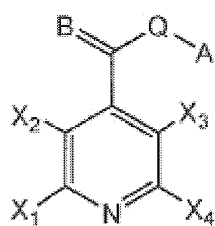
nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E).

[17] Phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật gồm: cho chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [8] hoặc hợp chất mục bất kỳ trong số các mục từ [9] đến [16] tiếp xúc với thân thực vật hoặc hạt giống, hoặc phối chế chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất vào trong nền canh tác.

[0011]

Sáng chế cũng bao gồm các phương án sau.

[P1] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật chứa, làm thành phần hoạt tính, hợp chất pyridin được thế flo của công thức (P1):



(P1)

[trong công thức (P1), A là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “nhóm thiol, nhóm metoxycarbonyl, nhóm N-tert-butoxycarbonylamino, và các nhóm thuộc nhóm C”;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được

chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcacbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy”;

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

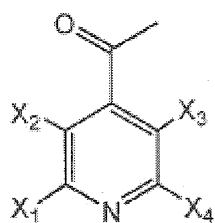
nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl”;

nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphthyl;

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm thuộc Nhóm E), hoặc

nhóm công thức (P2):



(P2),

nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-metyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D,

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm benzylaminocacbonyl, nhóm nitro, và nhóm xyano,

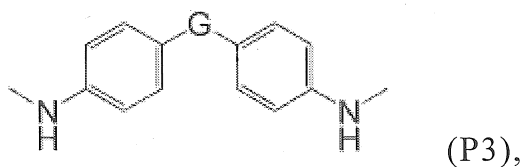
Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, và nhóm triazolyl,

B là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH- , hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-N(CH}_3\text{)-}$,

khi A là nhóm có công thức (P2),

Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $\text{-O-(CH}_2\text{)}_n\text{-O-}$, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-(CH}_2\text{)}_n\text{-O-}$, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-(CH}_2\text{)}_n\text{-NH-}$, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-O-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-O-}$, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-O-}$, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-CH}_2\text{-CH=CH-CH}_2\text{-NH-}$, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-}$, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: $\text{-NH-(1,4-phenylen)-O-}$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (P3):



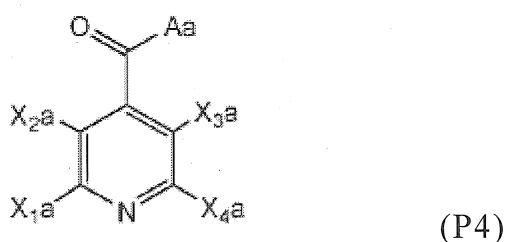
trong đó G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{SO}_2-$,

n là số nguyên từ 2 đến 8,

X_1 và X_4 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl, miễn là ký hiệu bất kỳ trong các ký hiệu này là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl,

X_2 và X_3 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm methyl, miễn là, khi bất kỳ một trong X_1 , X_2 và X_4 là nguyên tử flo, ký hiệu bất kỳ trong hai ký hiệu còn lại của công thức này không là nguyên tử hydro],

công thức (P4):



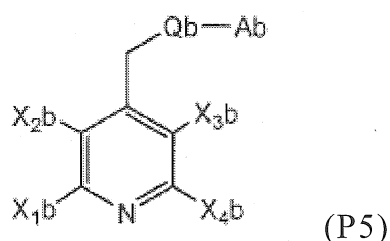
[trong công thức (P4), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl,

X_{1a} và X_{4a} là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc

nhóm triflometyl, miễn là ký hiệu bất kỳ của nó là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl,

X_{2a} và X_{3a} là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm metyl],

công thức (P5):



[trong công thức (P5), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

Ab là: nguyên tử hydro,

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “nhóm metoxycarbonyl, nhóm N-tert-butoxycarbonylamino, và các nhóm thuộc nhóm C”;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl; hoặc

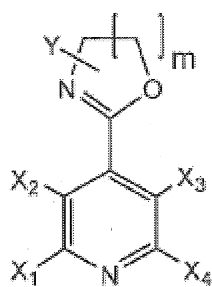
nhóm dị vòng được chọn từ nhóm E, mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D,

Nhóm D và Nhóm E như được xác định ở trên,

X_{1b} và X_{4b} là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, hoặc nguyên tử clo, miễn là ký hiệu bất kỳ trong các ký hiệu này là nguyên tử flo, và

X_{2b} và X_{3b} là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm metyl], hoặc,

công thức (P6):



(P6)

[trong công thức (P6), X_1 , X_2 , X_3 và X_4 là giống như được xác định ở trên,

m là số nguyên từ 1 đến 3, và

Y là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm metyl].

[P2] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục [P1], trong đó X_1 , X_2 , X_3 và X_4 trong công thức (P1) là các nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử flo.

[P3] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục [P1], trong đó, trong công thức (P1), X_1 và X_4 là các nguyên tử flo, và một trong X_2 và X_3 là nguyên tử hydro.

[P4] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục [P1], trong đó, trong công thức (P1), X_1 và X_4 là các nguyên tử flo, và X_2 và X_3 là các nguyên tử hydro.

[P5] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P1] đến [P4], trong đó B trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P1] là

nguyên tử oxy.

[P6] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P1] đến [P5], trong đó Q trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P1] là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.

[P7] Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P1] đến [P6], trong đó A trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P1] là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy”;

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl”; hoặc

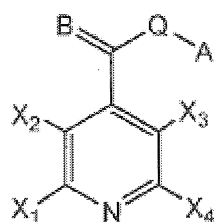
dị vòng được chọn từ nhóm E, mà có thể được thế với từ một đến

bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl, nhóm nitro, và nhóm xyano, và

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1- dioxidyl.

[P8] Hợp chất pyridin được thế flo được biểu diễn bởi công thức (P1):



(P1)

[trong công thức (P1), A là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “nhóm thiol, nhóm metoxycarbonyl, nhóm N-tert-butoxycarbonylamino, và các nhóm thuộc nhóm C”;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm

được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy”;

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

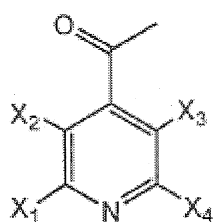
nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl”;

nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl;

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm thuộc Nhóm E), hoặc

nhóm công thức (P2):



(P2)

nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-metyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D,

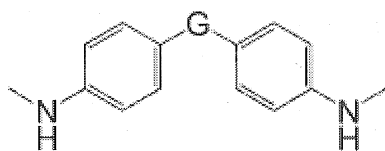
Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, nhóm

metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl, nhóm benzylaminocarbonyl, nhóm nitro, và nhóm xyano,

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, và nhóm triazolyl,

B là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{N}(\text{CH}_3)-$, miễn là, khi A là nhóm có công thức (P2), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-\text{O}-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-(\text{CH}_2)_n-\text{NH}-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{O}-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-(\text{xyclohexan-1,4-diyl})-\text{O}-$, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{NH}-(1,4\text{-phenylen})-\text{O}-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (P3):



(P3),

trong đó G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-\text{SO}_2-$,

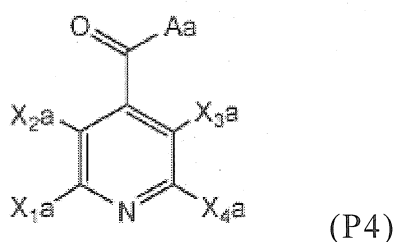
n là số nguyên từ 2 đến 8,

X_1 và X_4 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro,

nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl, miễn là ký hiệu bất kỳ trong các ký tự này là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl,

X_2 và X_3 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm metyl, miễn là, khi bất kỳ một trong X_1 , X_2 và X_4 là nguyên tử flo, ký hiệu bất kỳ trong hai ký hiệu còn lại của công thức này không là nguyên tử hydro],

công thức (P4):

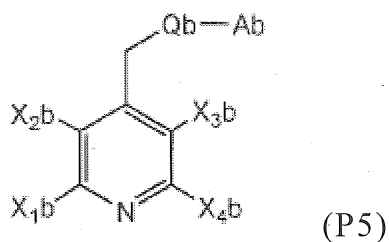


[trong công thức (P4), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl,

X_{1a} và X_{4a} là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl, miễn là ký hiệu bất kỳ trong các ký hiệu này là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl,

X_{2a} và X_{3a} là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm metyl],

công thức (P5):



[trong công thức (P5), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-,

Ab là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “nhóm metoxycarbonyl, nhóm N-tert-butoxycarbonylamino, và các nhóm thuộc nhóm C”;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl; hoặc

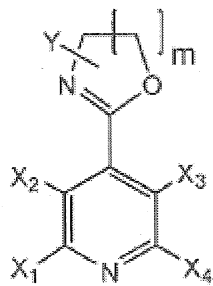
nhóm dị vòng được chọn từ nhóm E, mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D,

Nhóm D và Nhóm E là giống như được xác định ở trên,

X_{1b} và X_{4b} là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, hoặc nguyên tử clo, miễn là ký hiệu bất kỳ trong các ký hiệu này là nguyên tử flo, và

X_{2b} và X_{3b} là nguyên tử hydro, nguyên tử clo, nguyên tử flo hoặc nhóm metyl], hoặc

công thức (P6):



(P6)

[trong công thức (P6), X₁, X₂, X₃ và X₄ là giống như được xác định ở trên,

m là số nguyên từ 1 đến 3, và

Y là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm metyl].

[P9] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục [P8], trong đó X₁, X₂, X₃ và X₄ trong công thức (P1) là các nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử flo.

[P10] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục [P8], trong đó, trong công thức (P1), X₁ và X₄ là các nguyên tử flo và một trong X₂ và X₃ là nguyên tử hydro.

[P11] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục [P8], trong đó, trong công thức (P1), X₁ và X₄ là các nguyên tử flo và X₂ và X₃ là các nguyên tử hydro.

[P12] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P8] đến [P11], trong đó B trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P8] là nguyên tử oxy.

[P13] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P8] đến [P12], trong đó Q trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P8] là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.

[P14] Hợp chất pyridin được thể flo theo mục bất kỳ trong số các mục từ

[P8] đến [P13], trong đó A trong công thức (P1) được mô tả ở mục [P8] là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy”;

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm “các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl”; hoặc

dị vòng được chọn từ nhóm E, mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl, nhóm nitro, và nhóm xyano,

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm benzoisothiazolyl, và nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1- dioxidyl.

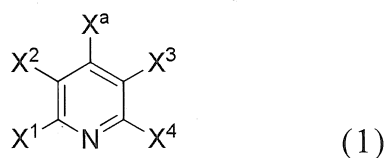
[P15] Phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật, bao gồm áp dụng chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo mục bất kỳ trong số các mục từ [P1] đến [P7] hoặc hợp chất pyridin được thể flo theo mục [P8] đến [P14] vào lá và thân của thực vật, đất, bề mặt nước của lúa nước mà trong đó lúa được phát triển, các vật mang mà thực vật phát triển trên đó, nước canh tác thủy canh (mà có thể chứa các chất dinh dưỡng), rễ thực vật, gốc ghép của chúng, rễ củ của chúng, thân củ của chúng, cây giống hoặc hạt giống.

Hiệu quả đạt được của sáng chế

Theo sáng chế, chất kiểm soát bệnh ở thực vật và hợp chất mới mà có thể làm giảm tổn hại đến thực vật, và phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật được đề xuất. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật và hợp chất mới theo sáng chế có các hoạt tính gây cảm ứng kháng bệnh ưu việt và có ích trong việc kiểm soát các bệnh ở thực vật.

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo phương án, sáng chế đề xuất chất kiểm soát bệnh ở thực vật chứa hợp chất có công thức (1) làm thành phần hoạt tính. Ngoài ra, theo phương án, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (1).

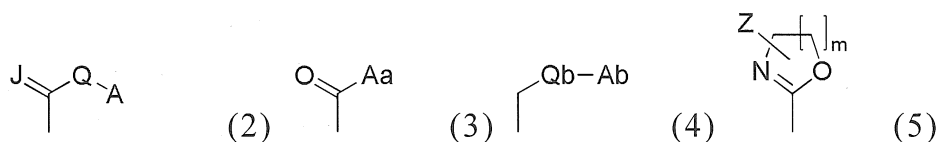


Trong công thức (1), X^1 và X^4 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm triflometyl,

miễn là bất kỳ một trong X^1 và X^4 là nguyên tử flo hoặc nhóm triflometyl. X^2 và X^3 có thể giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, nguyên tử flo, nguyên tử clo hoặc nhóm metyl, miễn là, trong công thức (1), khi bất kỳ một trong X^1 , X^2 và X^4 là nguyên tử flo, ký hiệu bất kỳ trong hai ký hiệu còn lại của công thức này không là nguyên tử hydro.

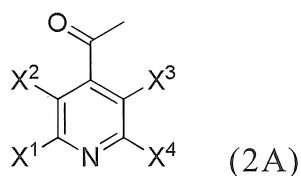
Tốt hơn là trong công thức (1) X^1 và X^4 là các nguyên tử flo, và X^2 và X^3 là các nguyên tử hydro hoặc các nguyên tử flo.

Trong công thức (1), X^a là nhóm có công thức (2), (3), (4) hoặc (5).

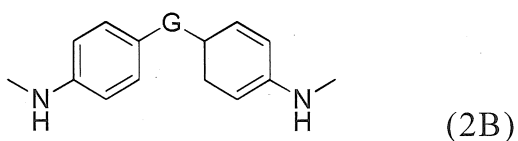


Trong công thức (2), J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh. Ngoài ra, trong công thức (2), A là: nhóm alkyl C1-12 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc nhóm C được đề cập dưới đây, nhóm thiol, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino, nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy; nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc nhóm D; nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến

năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl; nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl; nhóm naphtyl; nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây); hoặc nhóm công thức (2A) [trong công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là giống như được xác định trong công thức (1)].



trong công thức (2), khi A là nhóm có công thức (2A), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-NH-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylodioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-$, nhóm 1,3-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(1,4-phenylen)-O-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B) [trong công thức (2B), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-SO_2-$] (mà trong đó n là số nguyên từ 2 đến 8).



Trong công thức (2), khi A không là nhóm có công thức (2A), Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-$,

hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-N(CH_3)-$.

Trong công thức (3), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm 1-metyl-1-1H-pyrol-2-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm indolin-1-yl, nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxit-2-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl.

Theo phương án, Aa trong công thức (3) có thể là nhóm từ Aa được đề cập ở trên mà loại trừ nhóm 1-metyl-1-1H-pyrol-2-yl, nhóm indolin-1-yl, và nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxit-2-yl.

Trong công thức (4), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-$ hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-N(CH_3)-$. Trong công thức (4), Ab là: nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nguyên tử hydro, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino; nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm phenylcarbonyl; hoặc nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E được đề cập dưới đây).

Theo phương án, Ab trong công thức (4) có thể là nhóm bất kỳ trong số các nhóm được tạo ra bằng cách loại bỏ nguyên tử hydro khỏi Ab nêu

trên.

Trong công thức (5), m là số nguyên từ 1 đến 3, và Z là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm metyl.

Nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-metyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, nhóm phenylcacbonyl, các nhóm pyridyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc nhóm D.

Nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm metylthio, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkylcacbonyl C1-4, nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm benzylaminocacbonyl, nhóm axetoxy, nhóm nitro, và nhóm xyano.

Nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm 2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl, nhóm dihydrothiazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, nhóm isothiazolyl, và nhóm triazolyl.

Theo phương án, hợp chất có thể là hợp chất ngoại trừ, từ các hợp chất có công thức (1), các hợp chất mà trong đó J và Q là các nguyên tử oxy, A là metyl, nhóm etyl nhóm hoặc nhóm xyclohexyl và các hợp chất mà trong đó J là nguyên tử oxy, Q là nhóm được biểu diễn bởi công thức: -NH-, và A là nhóm 3-clo-4-flophenyl.

Theo phương án sáng chế, thuật ngữ “nhóm alkyl C1-12” nghĩa là nhóm alkyl C1-12 thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng. Các ví dụ về nhóm alkyl C1-12 gồm có nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm sec-butyl, nhóm isobutyl, nhóm tert-butyl, nhóm n-octyl, nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, và nhóm xyclohexyl, và các ví dụ ưu tiên của chúng gồm có nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm isobutyl, nhóm tert-butyl, nhóm xyclopropyl, nhóm xyclohexyl, và nhóm n-octyl.

Thuật ngữ “nhóm alkenyl C2-8” nghĩa là nhóm alkenyl thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng có ít nhất một liên kết đôi tại vị trí tùy ý của nhóm alkyl C2-8. Các ví dụ về nhóm alkenyl C2-8 gồm có nhóm etenyl, nhóm 1-propenyl, nhóm 2-propenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm isopropenyl, nhóm 3-butenyl, nhóm 4-pentenyl, nhóm 5-hexenyl, và nhóm 1-xyclohexenyl, và nhóm alkenyl C2-8 tốt hơn là nhóm 2-propenyl.

Thuật ngữ “nhóm alkynyl C2-8” nghĩa là nhóm alkynyl thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng có ít nhất một liên kết ba tại vị trí tùy ý của nhóm C2-8 alkyl. Các ví dụ về nhóm alkynyl C2-8 gồm có nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 3-butynyl, và nhóm xyclopropyletynyl, và nhóm alkynyl C2-8 tốt hơn là nhóm 2-propynyl.

Thuật ngữ “nhóm alkyloxy C1-4” nghĩa là nguyên tử oxy được thể với nhóm alkyl C1-4 thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng. Các ví dụ về nhóm alkyloxy C1-4 gồm có nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm iso-propyloxy, nhóm n-butoxy, nhóm sec-butoxy, nhóm isobutoxy, nhóm tert-butoxy, nhóm xyclopropyloxy, và nhóm xyclobutyloxy, và nhóm alkyloxy C1-4 tốt hơn là nhóm metoxy.

Thuật ngữ “nhóm alkylcarbonyl C1-8” nghĩa là nhóm carbonyl được thể với nhóm alkyl C1-8 thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng. Các ví dụ về

nhóm alkylcacbonyl C1-8 gồm có nhóm etylcacbonyl, nhóm n-propylcacbonyl, nhóm iso-propylcacbonyl, nhóm n-butylcacbonyl, nhóm sec-butylcacbonyl, nhóm isobutylcacbonyl, nhóm tert-butylcacbonyl, nhóm n-octylcacbonyl, nhóm xyclopropylcacbonyl, nhóm xyclobutylcacbonyl, nhóm xyclopentylcacbonyl, và nhóm xyclohexylcacbonyl.

Thuật ngữ “nhóm alkylsulfonyl C1-8” nghĩa là nhóm sulfonyl được thế với nhóm alkyl C1-8 thẳng, được phân nhánh, hoặc vòng. Các ví dụ về nhóm alkylsulfonyl C1-8 gồm có nhóm metylsulfonyl, nhóm etylsulfonyl, nhóm n-propylsulfonyl, nhóm iso-propylsulfonyl, nhóm n-butylsulfonyl, nhóm sec-butylsulfonyl, nhóm isobutylsulfonyl, nhóm tert-butylsulfonyl, nhóm n-octylsulfonyl, nhóm xyclopropylsulfonyl, nhóm xyclobutylsulfonyl, nhóm xyclopentylsulfonyl, và nhóm xyclohexylsulfonyl.

Các ví dụ về nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl gồm có nhóm 5,6,7,8-tetrahydronaphtalen-1-yl, và nhóm 5,6,7,8-tetrahydronaphtalen-2-yl.

Các ví dụ về nguyên tử halogen gồm có nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom và nguyên tử iốt.

Nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O- là nhóm hóa trị hai mà trong đó nhóm được biểu diễn bởi công thức: -NH- và nguyên tử oxy được liên kết tại vị trí thứ nhất và vị trí thứ tư của vòng xyclohexan, một cách tương ứng.

Nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(1,4-phenylen)-O- là nhóm hóa trị hai mà trong đó nhóm được biểu diễn bởi công thức: -NH- và nguyên tử oxy được liên kết tại vị trí thứ nhất và vị trí thứ tư của vòng benzen, một cách tương ứng.

Theo sáng chế, ký hiệu “-” mà liên kết các nguyên tử và/hoặc các nhóm trong công thức biểu diễn liên kết đơn, và ký hiệu “=” biểu diễn liên kết đôi, trừ khi có quy định khác. Ví dụ, trong công thức (1), ký hiệu “-” biểu diễn liên kết đơn, và ký hiệu “=” biểu diễn liên kết đôi. Ví dụ, trong trường hợp mà ở đó Q trong công thức (2) là nhóm có công thức hóa trị hai: -O-(CH₂)_n-O-, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(CH₂)_n-O-, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(CH₂)_n-NH-, nhóm công thức hóa trị hai: -O-CH₂-CH=CH-CH₂-O-, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-CH₂-CH=CH-CH₂-O-, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-CH₂-CH=CH-CH₂-NH-, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-, nhóm 1,3-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(1,4-phenylen)-O-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B), ký hiệu “-” trong các nhóm này biểu diễn liên kết đơn, và ký hiệu “=” biểu diễn liên kết đôi.

Trong Nhóm D, các ví dụ về nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen gồm có nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm sec-butyl, nhóm isobutyl, nhóm tert-butyl, nhóm triflometyl, nhóm clometyl, nhóm metoxy, và nhóm etoxy.

Trong Nhóm D, các ví dụ về nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen gồm có nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propyloxy, nhóm iso-propyloxy, nhóm n-butyloxy, nhóm sec-butyloxy, nhóm isobutyloxy, nhóm tert-butyloxy, nhóm triflometyloxy, và nhóm clometyloxy.

A trong công thức (2) tốt hơn là: nhóm alkyl C1-4 mà có thể được

thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkenyl C2-3 mà có thể được thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm alkynyl C2-3 mà có thể được thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, hoặc nhóm phenyl mà có thể được thể với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc nhóm D.

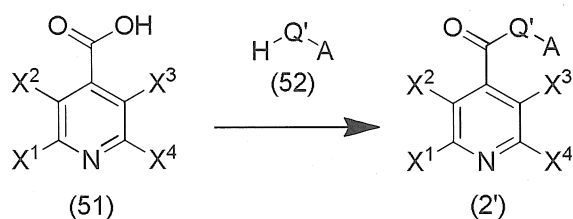
Trong công thức (2), J tốt hơn nữa là là nguyên tử oxy.

Trong công thức (2), Q tốt hơn nữa là là nguyên tử oxy hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -NH-.

Có trường hợp mà ở đó hợp chất có công thức (1) tồn tại dưới dạng hydrat hoặc solvat tùy ý, và hydrat hoặc solvat được bao gồm trong phương án sáng chế. Ngoài ra, có trường hợp mà ở đó hợp chất có công thức (1) có cacbon bất đối xứng, cacbon bất đối xứng có thể theo cấu hình tùy ý. Các chất đồng phân lập thể như các đồng phân quang học ở dạng tinh khiết dựa trên cacbon bất đối xứng hoặc các đồng phân không đối quang, các hỗn hợp của các chất đồng phân lập thể, các chất triệt quang, và chất tương tự bất kỳ được bao gồm trong phương án sáng chế. Hợp chất của công thức (1) có thể có ít nhất một liên kết đôi, và có thể có các chất đồng phân hình học được dẫn xuất từ liên kết đôi hoặc cấu trúc vòng. Các hỗn hợp của các chất đồng phân hình học bất kỳ hoặc bất kỳ chất đồng phân hình học nào ở dạng tinh khiết cũng được bao gồm bởi phương án sáng chế.

Tiếp theo, các phương pháp điều chế hợp chất theo phương án sáng chế sẽ được giải thích. Mặc dù hợp chất theo phương án sáng chế có thể được điều chế bằng các phương pháp từ A đến K được đề cập dưới đây, ví dụ, phương pháp điều chế hợp chất theo phương án sáng chế không bị giới hạn ở các phương pháp này.

Phương pháp A



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (2') được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (52) (trong công thức (52), A giống như được xác định trong công thức (2), Q' là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai: -N(CH₃)-) với sự có mặt hoặc vắng mặt của bazơ và với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.

Như hợp chất có công thức (51), mà là các nguyên liệu ban đầu, có thể sử dụng chất phản ứng có bán sẵn trên thị trường hoặc có thể sử dụng hợp chất tổng hợp. Hợp chất của công thức (51) có thể được tổng hợp bằng phương pháp được mô tả trong Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Sho 63-93766, Đơn sáng chế Nhật Bản đang được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 1-283270, R. E. Banks, và cộng sự., các hợp chất polyflo dị vòng. Phần XII. Tổng hợp và một số phản ứng của 2,3,5,6-tetraflo-4-iodopyridin, J. Chem. Soc. (C), 2091-2095 (1967), hoặc tài liệu tương tự.

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có diclometan, cloroform, axetonitril, etyl axetat, toluen, tetrahydrofuran, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon và dimetyl sulfoxit.

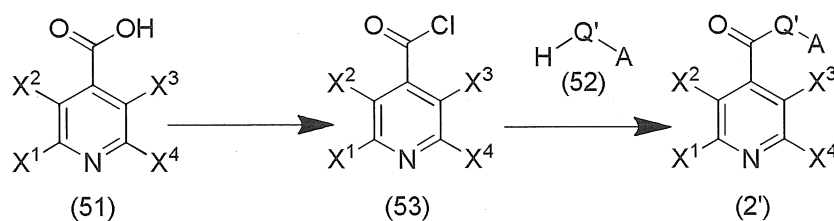
Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacbodiimit hydroclorua và 1,3-dixyclohexylcacbodiimit.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 4-dimethylaminopyridin. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,01 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Lượng hợp chất có công thức (52) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Nhiệt độ phản ứng được chọn trong phạm vi từ 0°C đến 60°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 40°C. Thời gian phản ứng ở, ví dụ, trong phạm vi từ 10 phút đến 24 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 4 giờ.

Phương pháp B



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (2') cũng có thể được điều chế bằng các phương pháp được đề cập dưới đây mà trong đó hợp chất có công thức (2') được điều chế từ hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) thông qua hợp chất có công thức (53) (trong công thức (53), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)).

Trong bước thứ nhất, hợp chất có công thức (53) được điều chế bằng cách clo hóa hợp chất có công thức (51).

Mặc dù tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, diclometan, cloroform, hoặc axetonitril có thể được sử dụng trong phản ứng như dung môi, phản

ứng có thể được thực hiện với sự vắng mặt của dung môi bất kỳ.

Các ví dụ về tác nhân clo hóa cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có thionyl clorua và oxalyl clorua. Lượng tác nhân clo hóa cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 5 đương lượng dựa trên hợp chất có công thức (51). Nhiệt độ phản ứng là, ví dụ, từ -20°C đến 100°C , và tốt hơn nữa là từ 10°C đến 80°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 2 giờ.

Tiếp theo, trong bước thứ hai, hợp chất có công thức (2') có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (53) và hợp chất có công thức (52) với sự có mặt của bazơ.

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit và các hỗn hợp của chúng.

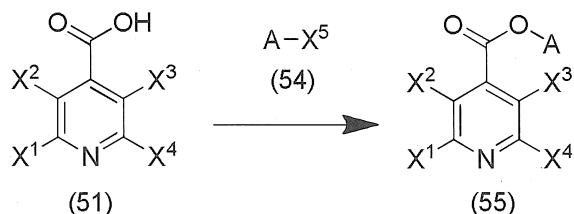
Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có triethylamin, N,N-diisopropyletylamin, pyridin, 4-dimetylaminopyridin, natri cacbonat, và kali cacbonat. Lượng bazơ cần phải được sử dụng là 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53).

Lượng hợp chất có công thức (52) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53). Nhiệt độ phản ứng ở, ví dụ, trong phạm vi từ -20°C đến 100°C , và tốt hơn là từ 10°C đến 50°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 3 giờ.

Hợp chất của công thức (2') cũng có thể được điều chế bằng cách bổ sung dung môi, tác nhân clo hóa, hợp chất có công thức (52), và bazơ vào hợp chất có công thức (51) để cho phép phản ứng diễn ra trong cùng bình

chứa mà không phân tách hợp chất có công thức (53).

Phương pháp C



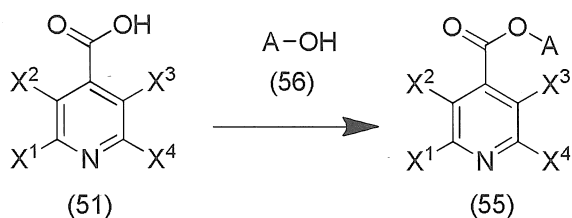
Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (55) có thể được điều chế bằng cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (54) (trong công thức (54), A giống như được xác định trong công thức (2), và X⁵ là nguyên tử halogen) với sự có mặt của bazơ.

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, và dimetyl sulfoxit.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có natri hydro cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydroxit, và kali hydroxit. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,5 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng hợp chất có công thức (54) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Nhiệt độ phản ứng, ví dụ, từ -20°C đến 120°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 80°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 8 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 6 giờ.

Phương pháp D

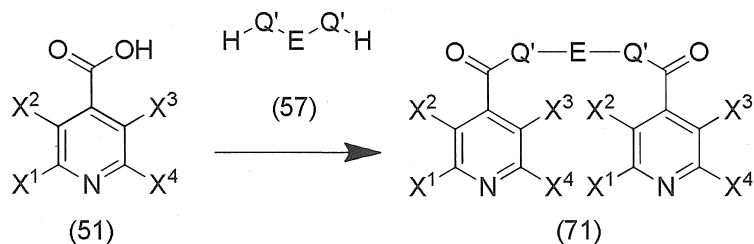


Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (55) cũng có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (56) (trong công thức (56), A giống như được xác định trong công thức (2)) với sự có mặt của axit.

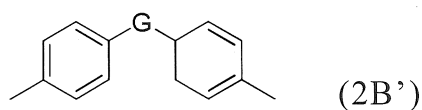
Mặc dù tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, hoặc dimetyl sulfoxit có thể được sử dụng như dung môi trong phản ứng, phản ứng có thể được thực hiện với sự vắng mặt của dung môi bất kỳ.

Lượng hợp chất có công thức (56) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Các ví dụ về axit cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có axit sulfuric và hydrogen clorua. Lượng axit cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,01 đương lượng đến 3 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Nhiệt độ phản ứng, ví dụ, từ -20°C đến 120°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 90°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 8 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 6 giờ.

Phương pháp E



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (71) có thể được điều chế bằng cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (57) (trong công thức (57), Q' là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-$ hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-N(CH_3)-$, E là nhóm công thức hóa trị hai: $-(CH_2)_n-$ (trong đó n là số nguyên từ 2 đến 4), nhóm công thức hóa trị hai: $-CH_2-CH=CH-CH_2-$, nhóm xyclohexan-1,4-diyl, nhóm 1,4-phenylen, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B') được đề cập dưới đây (trong công thức (2B'), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-SO_2-$)) với sự có mặt hoặc vắng mặt của bazơ, và với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.



Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có diclometan, cloroform, axetonitril, etyl axetat, toluen, tetrahydrofuran, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, và dimetyl sulfoxit.

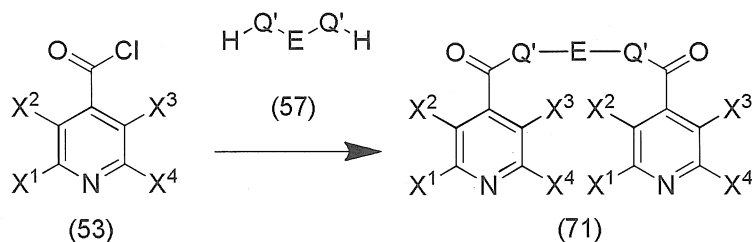
Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacbodiimit hydroclorua và 1,3-dixyclohexylcacbodiimit.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 4-dimetylaminopyridin. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,01 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng hợp chất có công thức (57) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,5 đương lượng đến 0,6 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Nhiệt độ phản ứng, ví dụ, từ 0°C đến 60°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 40°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 24 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 18 giờ.

Phương pháp F



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (71) cũng có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (53) (trong công thức (53), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (57) (trong công thức, Q' và E giống như được xác định trong công thức (57) được mô tả trong phương pháp E) với sự có mặt của bazơ.

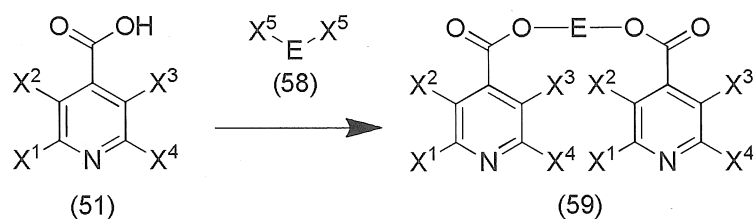
Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit và các hỗn hợp của chúng.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có trietylamin, N,N-diisopropyletylamin, pyridin, 4-dimetylaminopyridin, natri cacbonat, và kali cacbonat. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53).

Lượng hợp chất có công thức (57) cần phải được sử dụng nằm trong

phạm vi từ 0,5 đương lượng đến 0,6 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53). Nhiệt độ phản ứng ở, ví dụ, trong phạm vi từ -20°C đến 100°C , và tốt hơn là 10°C đến 50°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 4 giờ.

Phương pháp G



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (59) có thể được điều chế bằng cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (58) (trong công thức (58), X^5 là nguyên tử halogen, và E giống như được xác định trong công thức (57) như được mô tả trong phương pháp E) với sự có mặt của bazơ.

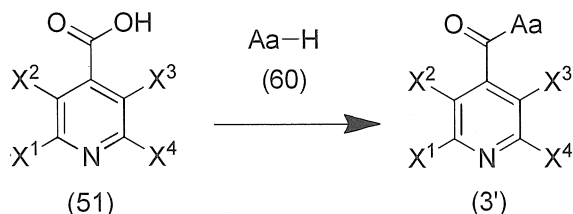
Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, và dimetyl sulfoxit.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có natri hydro cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydroxit, và kali hydroxit. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,1 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng hợp chất có công thức (58) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,5 đương lượng đến 0,6 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 120°C , và tốt hơn là từ 10°C đến 80°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến

8 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 6 giờ.

Phương pháp H



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (3') có thể được điều chế bằng cho phản ứng hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (60) (trong công thức (60), Aa giống như được xác định trong công thức (3)) với sự có mặt hoặc vắng mặt của bazơ, và với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có diclometan, cloroform, axetonitril, etyl axetat, toluen, tetrahydrofuran, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, và dimetyl sulfoxit.

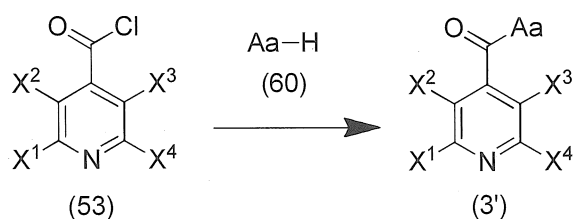
Các ví dụ về tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacbodiimit hydroclorua, và 1,3-dixyclohexylcacbodiimit.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có 4-dimetylaminopyridin. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,01 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Lượng tác nhân ngưng tụ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51). Lượng hợp chất có công thức (60) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1,0 đương lượng đến 1,2 đương lượng dựa trên axit cacboxylic (51).

Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ 0°C đến 60°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 40°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 3 giờ.

Phương pháp I



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (3') cũng có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (53) (trong công thức (53), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (60) (trong công thức (60), Aa giống như được xác định trong công thức (3)) với sự có mặt của bazơ.

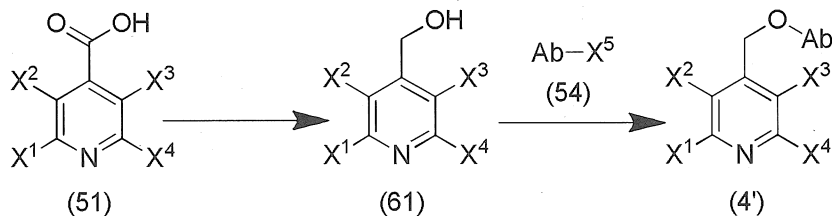
Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit và các hỗn hợp của chúng.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có trietylamin, N,N-diisopropyletylamin, pyridin, 4-dimetylaminopyridin, natri cacbonat, và kali cacbonat. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53).

Lượng hợp chất có công thức (60) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53). Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 100°C, và tốt hơn là từ 10°C đến 50°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ

10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 4 giờ.

Phương pháp J



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (4') có thể được điều chế bằng phương pháp được đề cập dưới đây từ hợp chất có công thức (51) (trong công thức (51), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)) thông qua hợp chất có công thức (61) (trong công thức (61), X¹, X², X³ và X⁴ giống như được xác định trong công thức (1)).

Trong bước thứ nhất, hợp chất có công thức (61) có thể được điều chế bằng cách khử hợp chất có công thức (51).

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, dimetoxietan, 1,4-dioxan, diclometan, cloroform, và toluen.

Các ví dụ về tác nhân khử cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có phức boran-tetrahydrofuran, và phức borane-dimetyl sulfua. Lượng tác nhân khử cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 3 đương lượng đến 6 đương lượng dựa trên hợp chất có công thức (51).

Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 80°C, và tốt hơn là từ 0°C đến 40°C. Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 8 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 6 giờ.

Tiếp theo, trong bước thứ hai, hợp chất có công thức (61) và hợp chất có công thức (54) (trong công thức (54), Ab giống như được xác định

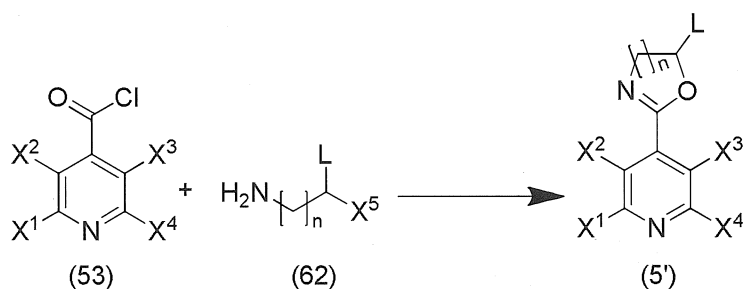
trong công thức (4), và X^5 là nguyên tử halogen) được phản ứng với sự có mặt của bazơ để thu được hợp chất có công thức (4').

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, etyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit và các hỗn hợp của chúng.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có triethylamin, N,N-diisopropyletylamin, pyridin, 4-dimetylaminopyridin, natri cacbonat, và kali cacbonat. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên hợp chất có công thức (61).

Lượng hợp chất có công thức (54) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên hợp chất có công thức (61). Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 100°C , và tốt hơn là từ 10°C đến 60°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 6 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 3 giờ.

Phương pháp K



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (5') có thể được điều chế bằng cho phản ứng hợp chất có công thức (53) (trong công thức (53), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (62) (trong công thức (62), X^5 là nguyên tử

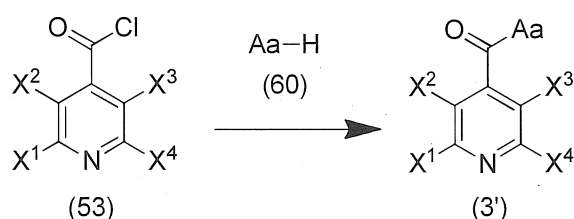
halogen, và L là nguyên tử hydro hoặc nhóm alkyl C1-4) với sự có mặt của bazơ.

Các ví dụ về dung môi cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có tetrahydrofuran, toluen, ethyl axetat, axetonitril, diclometan, cloroform, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit và các hỗn hợp của chúng.

Các ví dụ về bazơ cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có triethylamin, N,N-diisopropyletylamin, pyridin, 4-dimetylaminopyridin, natri cacbonat, và kali cacbonat. Lượng bazơ cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53).

Lượng hợp chất có công thức (62) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 1 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53). Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 100°C , và tốt hơn là từ 10°C đến 90°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 10 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 8 giờ.

[Phương pháp L]



Trong số các hợp chất có công thức (1), hợp chất có công thức (3') cũng có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức (53) (trong công thức (53), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 giống như được xác định trong công thức (1)) và hợp chất có công thức (60) (trong công thức (60), Aa giống như được xác định trong công thức (3)) với sự có mặt hoặc vắng mặt

của axit.

Mặc dù toluen, diclometan, cloroform, dicloetan, N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit, nitrometan, nitrobenzen hoặc hỗn hợp của chúng có thể được sử dụng như dung môi trong phản ứng, phản ứng có thể được thực hiện với sự vắng mặt của dung môi bất kỳ,

Các ví dụ về axit cần phải được sử dụng trong phản ứng gồm có nhôm triclơua, nhôm tribromua, lanthanoit triflat, zeolit, axit sulfuric, axit phosphoric, axit axetic, axit trifloaxetic, axit clohydric, axit p-toluensulfonic, sắt (III) clorua, kẽm diclơua, axit polyphosphoric, titan tetracloerua, titan tetrabromua, thiếc clorua, và kẽm triflometansulfonat. Lượng axit cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,01 đương lượng đến 10 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53).

Lượng hợp chất có công thức (60) cần phải được sử dụng nằm trong phạm vi từ 0,5 đương lượng đến 2 đương lượng dựa trên clorua axit cacboxylic (53). Nhiệt độ phản ứng nằm trong phạm vi từ -20°C đến 250°C , và tốt hơn là từ 10°C đến 100°C . Thời gian phản ứng nằm trong phạm vi từ 10 phút đến 48 giờ, và tốt hơn là từ 30 phút đến 16 giờ.

Các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (2'')

Trong số các hợp chất có công thức (1), các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (2'') được thể hiện trong các bảng từ 1 đến 8 dưới đây.

Trong các hợp chất cụ thể được biểu diễn bởi công thức (2''), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là dạng kết hợp của các nhóm thế được thể hiện trong bảng 1 dưới đây, và Q và A là dạng kết hợp của các nhóm thế được thể hiện trong bảng 2 đến bảng 8, J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh.

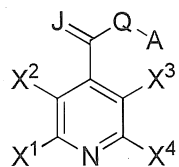
Theo sáng chế, các từ viết tắt được đề cập dưới đây có thể được sử

dụng.

n: thường (normal)

sec: bậc hai (secondary)

tert: bậc ba (tertiary)



(2'')

Bảng 1

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Q, A
F	H	H	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,
F	F	H	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,
F	H	H	Cl	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,
F	F	H	Cl	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,
F	F	F	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,
F	Cl	F	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong các bảng từ 2 đến 8,

Bảng 2

Q	A
O	H
O	metyl

O	etyl
O	2,2,2-trifloetyl
O	n-propyl
O	3,3,3-triflopropyl
O	n-octyl
O	isobutyl
O	1,1,1-triflopropan-2-yl
O	isopropyl
O	propargyl
O	3,3-dicloallyl
O	etoxycacbonylmetyl
NH	tert-butyl
NH	2-aminoetyl
NH	metyl
NH	xyanometyl
NH	etyl
NH	isopropyl
NH	2-brometyl
NH	n-propyl
NH	Allyl
NH	xyclohexyl
NH	xyclopropyl
NH	n-octyl
NH	2-(N-tert-butoxycacbonyl)aminoetyl
O	allyl
NH	2-metoxetyl
NH	2-hydroxyetyl

NH	2-mercaptetyl
NH	metoxycacbonylmetyl
NH	metoxy
O	benzyl

Bảng 3

Q	A
O	2-clobenzyl
O	3-clobenzyl
O	4-clobenzyl
O	4-metoxybenzyl
O	4-metylbenzyl
O	2-(metoxycacbonyl)benzyl
NH	benzyl
NH	benzoyl
O	3,4-dicloisothiazol-5-yl
O	(5-metyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-yl)metyl
NH	5,6,7,8-tetrahydronaphatalen-2-yl
NH	2-benzimidazolyl
NH	2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl
NH	4,5-dihydrothiazol-2-yl
NH	2-metoxycacbonylthiophen-3-yl
NH	2-pyrazinyl
NH	2-pyridyl
NH	2-pyrimidinyl
NH	2-thiazolyl
NH	3-xyano-4-metyl-thiophen-2-yl

NH	3-xyanothiophen-2-yl
NH	3-metoxycacbonylthiofen-2-yl
NH	dibenzo[b,d]furan-3-yl
NH	3-pyridazinyl
NH	3-pyridyl
NH	3-triazolyl
NH	4-metoxypyridin-2-yl
NH	4-pyridyl
NH	5-metylisoxazol-3-yl
NH	5-metylthiazol-2-yl
O	2-xyanophenyl
O	2-metoxyphenyl
O	4-clophenyl

Bảng 4

Q	A
O	4-xyanophenyl
O	4-metylphenyl
O	4-nitrophenyl
O	xinnamyl
O	phenyl
NH	phenyl
NCH3	3-isopropyloxyphenyl
NCH3	phenyl
NH	2-flophenyl
NH	3-flophenyl
NH	4-flophenyl

NH	2-bromphenyl
NH	3-bromphenyl
NH	4-bromphenyl
NH	2-iotphenyl
NH	3-iotphenyl
NH	4-iotphenyl
NH	2-etylphenyl
NH	3-etylphenyl
NH	4-etylphenyl
NH	2-n-propylphenyl
NH	3-n-propylphenyl
NH	4-n-propylphenyl
NH	2-n-butylphenyl
NH	3-n-butylphenyl
NH	4-n-butylphenyl
NH	2-sec-butylphenyl
NH	3-sec-butylphenyl
NH	4-sec-butylphenyl
NH	2-isobutylphenyl
NH	3-isobutylphenyl
NH	4-isobutylphenyl
NH	2,3,5,6-tetroflo-4-triflometylphenyl

Bảng 5

Q	A
NH	2,3-diclophenyl
NH	2,4,6-trimetylphenyl

NH	2,6-dimethylphenyl
NH	2-clophenyl
NH	2-xyano-4-nitrophenyl
NH	2-metylphenyl
NH	3,4,5-triclophenyl
NH	3,4,5-trimetoxyphenyl
NH	3,4-diflophenyl
NH	3,4-dimetoxyphenyl
NH	3,4-dimethylphenyl
NH	3,5-diclophenyl
NH	3,5-dimetoxyphenyl
NH	3,5-dimethylphenyl
NH	3-benzylphenyl
NH	3-brom-4-metylphenyl
NH	3-clo-4-flophenyl
NH	3-clo-4-metylphenyl
NH	3-clo-4-triflometylphenyl
NH	3-clophenyl
NH	3-xyanophenyl
NH	3-etoxyacbonylphenyl
NH	2-etoxyphenyl
NH	3-etoxyphenyl
NH	3-flo-4-metylphenyl
NH	3-iot-4-metylphenyl
NH	2-n-propyloxyphenyl
NH	3-n-propyloxyphenyl
NH	4-n-propyloxyphenyl

NH	2-n-butyloxyphenyl
NH	3-n-butyloxyphenyl
NH	4-n-butyloxyphenyl
NH	2-sec-butyloxyphenyl

Bảng 6

Q	A
NH	3-sec-butyloxyphenyl
NH	4-sec-butyloxyphenyl
NH	2-isobutyloxyphenyl
NH	3-isobutyloxyphenyl
NH	4-isobutyloxyphenyl
NH	2-tert-butyloxyphenyl
NH	3-tert-butyloxyphenyl
NH	4-tert-butyloxyphenyl
NH	2-triflometoxyphenyl
NH	2-xyanophenyl
NH	4-clo-3benzylaminocacbonylphenyl
NH	2-triclometyloxyphenyl
NH	3-triclometyloxyphenyl
NH	4-triclometyloxyphenyl
NH	2-isopropyloxyphenyl
NH	3-isopropyloxyphenyl
NH	3-isopropylphenyl
NH	2-metoxyphenyl
NH	3-metoxyphenyl
NH	3-metylphenyl

NH	3-phenoxyphenyl
NH	3-tert-butoxyphenyl
NH	3-triflometoxyphenyl
NH	3-triflometylphenyl
NH	4-clo-3-flophenyl
NH	4-clophenyl
NH	4-xyanophenyl
NH	4-etoxycacbonylphenyl
NH	4-etoxyphenyl
NH	4-flo-3-metylphenyl
NH	4-isopropyloxyphenyl
NH	2-isopropylphenyl
NH	3-isopropylphenyl

Bảng 7

Q	A
NH	4-isopropylphenyl
NH	4-metoxyphenyl
NH	4-metyl-3-metoxyphenyl
NH	4-metyl-3-nitrophenyl
NH	4-metyl-3-triflometylphenyl
NH	4-metylphenyl
NH	4-nitrophenyl
NH	4-phenoxyphenyl
NH	4-tert-butoxyphenyl
NH	2-tert-butylphenyl
NH	3-tert-butylphenyl

NH	4-tert-butylphenyl
NH	4-triflometoxyphenyl
NH	2-hydroxy-1-phenyletyl
NH	1-(2,4-diclophenyl)etyl
NH	1-(4-clophenyl)etyl
NH	1-phenyletyl
NH	phenylsulfonyl
NH	H
O	4-etylphenyl
O	3-metoxyphenyl
O	2-etoxy-2-oxoetyl
NH	4-triflometylphenyl
NH	2-phenyletyl
NH	3,4-diclophenyl
NH	4-tert-butyl-2-flophenyl
NH	propargyl
NH	phenylcacbonylmetyl
NH	2-nitrophenyl
NH	(6-clopyridin-3-yl)metyl
NH	3-nitrophenyl
NH	4-n-hexylphenyl
O	propagyl

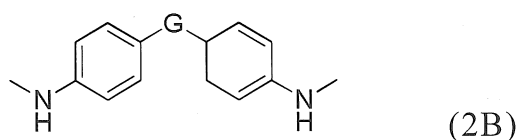
Bảng 8

Q	A
NH	3-axetylphenyl
NH	3-(metylthio)phenyl

NH	3-hydroxyphenyl
NH	benzo[d]thiazol-2-yl
NH	(3-(2,6-diflopyridin-4-ylcacbonylamino)phenyl)amino
NH	3-aminophenyl
NH	4-clo-3-nitrophenyl
O	4-metoxyphenyl
O	naphtalen-1-yl
O	xyclohexyl
O	3-metylphenyl
O	3-flophenyl
O	2-metylphenyl
O	2-clophenyl
O	2-flophenyl
O	3-clophenyl
O	n-hexyl
O	n-dodexyl
O	phenetyl
O	4-isopropylphenyl

Trong số các hợp chất có công thức (2''), trong các ví dụ cụ thể về hợp chất mà trong đó A là nhóm công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là dạng kết hợp của các nhóm thể được thể hiện trong bảng 9 dưới đây, Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-NH-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm

xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-, nhóm 1,3-phenyldiamino, nhóm 1,4-phenyldiamino, nhóm 1,4-phenyldioxy, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-(1,4-phenylen)-O-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B).



Bảng 9

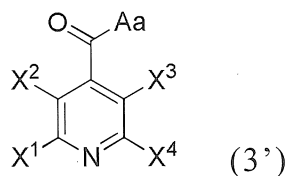
X ¹	X ²	X ³	X ⁴
F	F	H	F
F	H	H	Cl
F	Cl	H	F
F	F	H	Cl
F	F	F	F
F	Cl	F	F

Các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (3')

Trong số các hợp chất có công thức (1), các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (3') được thể hiện trong bảng 10 dưới đây.

Trong các hợp chất cụ thể được biểu diễn bởi công thức (3'), X¹, X², X³ và X⁴ là dạng kết hợp của các nhóm thế được thể hiện trong bảng 10 dưới đây, và Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm 1-metyl-1-1H-pyrrol-2-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm indolin-1-yl, nhóm benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxit-2-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm

5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm isoindolin-2-yl.



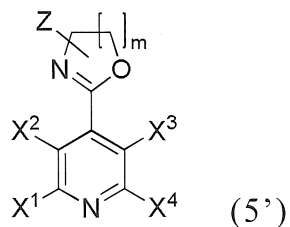
Bảng 10

X ¹	X ²	X ³	X ⁴
F	H	H	Cl
F	Cl	H	F
F	F	H	Cl
F	F	F	F
F	Cl	F	F

Các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (5')

Trong số các hợp chất có công thức (1), các ví dụ cụ thể về hợp chất có công thức (5') được thể hiện trong các bảng 11 và 12 dưới đây.

Trong các hợp chất cụ thể được biểu diễn bởi công thức (5'), X¹, X², X³ và X⁴ là dạng kết hợp của các nhóm thế được thể hiện trong bảng 11 dưới đây, và các dạng kết hợp của các nhóm thế như Z, các vị trí thế của chúng, và m được thể hiện trong bảng 12 dưới đây.



Bảng 11

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Z, m
----------------	----------------	----------------	----------------	------

F	F	H	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.
F	H	H	Cl	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.
F	Cl	H	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.
F	F	H	Cl	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.
F	F	F	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.
F	Cl	F	F	Các dạng kết hợp được thể hiện trong bảng 12.

Bảng 12

Z	m
4-metyl	1
5-metyl	1
4-clo	1
5-clo	1
4-flo	1
5-flo	1
4-metyl	2
5-metyl	2
4-clo	2
5-clo	2
4-flo	2
5-flo	2
4-metyl	3
5-metyl	3
6-metyl	3
4-clo	3
5-clo	3
6-clo	3

4-flo	3
5-flo	3
6-flo	3

Các mầm gây bệnh cho thực vật

Mặc dù mầm gây bệnh cho thực vật được kiểm soát bởi chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo phương án sáng chế không bị giới hạn cụ thể, các ví dụ của chúng gồm có nấm, vi khuẩn, và virút.

Các ví dụ về nấm gây bệnh cho thực vật gồm có *Alternaria alternata*, *Alternaria kikutiana*, *Botrytis cinerea*, *Cochliobolus miyabeanus*, *Colletotrichum atramentarium*, *Colletotrichum lagenarium*, *Fusarium oxysporum* f. sp. *cucumerium*, *Fusarium oxysporum* f. sp. *lycopersici*, *Gibberella fujikuroi*, *Glomerella cingulata*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Sclerotinia minor*, *Verticillium albo-atrum*, *Puccinia recondita*, *Erysiphe graminis*, *Phytophthora infestans*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Alternaria solani*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Venturia inaequalis*, *Monilinia fructicola*, *Colletotrichum gloeosporioides*, *Cercospora kikuchii*, *Cercospora beticola*, *Leptosphaeria nodorum*, và *Blumeria graminis*. Các ví dụ ưu tiên về nấm gây bệnh cho thực vật gồm có *Pyricularia oryzae*, *Blumeria graminis*, *Puccinia recondita*, và *Erysiphe graminis*.

Các ví dụ về vi khuẩn gây bệnh cho thực vật gồm có loài *Pseudomonas*, loài *Erwinia*, loài *Pectobacterium*, loài *Xanthomonas*, loài *Burkholderia*, loài *Streptomyces*, loài *Ralstonia*, loài *Clavibacter*, loài *Rhizomonas*, loài *Agrobacterium*, loài *Bacillus*, loài *Clostridium*, loài *Curtobacterium*, loài *Pantoea*, loài *Acidovorax*, loài *Arthrobacter*, và loài *Rhodococcus*. Các ví dụ ưu tiên về vi khuẩn gây bệnh cho thực vật gồm có loài *Xanthomonas*, và chủng *Xanthomonas oryzae*. *Oryzae* được ưu tiên

trong loài *Xanthomonas*.

Các ví dụ về virút gây bệnh cho thực vật gồm có virút khảm lúa mỳ đất, virút khảm đậu nành, virút khảm cỏ linh lăng, virút gây xoắn lá khai tây, virút khảm dưa chuột, và virút khảm thuốc lá.

Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo phương án sáng chế chứa hợp chất có công thức (1), làm thành phần hoạt tính của nó. Theo sáng chế, cụm từ “chứa hợp chất có công thức (1), làm thành phần hoạt tính của nó” nghĩa là hợp chất có công thức (1) được chứa với lượng xấp xỉ sao cho bệnh ở thực vật các tác dụng kiểm soát được thể hiện, và lượng của nó không bị giới hạn cụ thể, miễn là hợp chất có công thức (1) được chứa làm thành phần hoạt tính dưới dạng thể tự do, hydrat, solvat tùy ý, hoặc muối.

Trong trường hợp mà ở đó chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo phương án sáng chế được sử dụng làm thành phần hoạt tính của chất kiểm soát bệnh trong nông nghiệp và trồng trọt, hợp chất nêu trên có thể được sử dụng trực tiếp, hoặc có thể được sử dụng dưới dạng chế phẩm (công thức) kiểm soát bệnh ở thực vật có dạng liều lượng tùy ý, như nhũ tương, dung dịch, huyền phù, bột thấm ướt được, bột, hạt, viên nén, dung dịch dầu, sol khí, hoặc tác nhân chảy được, được điều chế bằng cách trộn theo cách thông thường hợp chất này với chất mang được phép sử dụng trong nông nghiệp và trồng trọt, như chất mang dạng rắn, chất mang dạng lỏng, chất mang dạng khí, chất hoạt động bề mặt, hoặc tác nhân phân tán. Chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật có thể còn chứa các chất bổ trợ công thức bổ sung.

Các ví dụ về chất mang khả dụng gồm có các chất mang dạng lỏng, các chất mang dạng rắn, các chất mang dạng khí, các chất hoạt động bề mặt, và các tác nhân phân tán. Các ví dụ về các chất bổ trợ công thức gồm có các chất thường được bào chế trong các chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật.

Các ví dụ về chất mang dạng rắn gồm có: bột mịn hoặc hạt đất sét (như đất sét cao lanh, đất diatomit, bentonit, và đất sét axit), oxit silic được hydrat hóa tổng hợp, talc, ceramic, hoặc các khoáng vô cơ bổ sung (như selenit, thạch anh, lưu huỳnh, cacbon hoạt tính, canxi cacbonat, và silic dioxit được hydrat hóa); tinh bột; lactoza; và các polyme tổng hợp như các polyme của vinyl clorua, và polyuretan.

Các ví dụ về các chất mang dạng lỏng gồm có: các rượu (như metanol, etanol, isopropanol, polyetylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, tripropylen glycol, và glyxerin); các keton (như axeton và metyl etyl keton); các hydrocacbon thơm (như rượu benzyl, benzen, toluen, xylen, etylbenzen, và metylnaphtalen); các hydrocacbon béo (như parafin, n- hexan, xyclohexan, kerosen, và dầu hỏa); các ete (như dietylen glycol monoetyl ete, dietylen glycol monometyl ete, diisopropyl ete, dietyl ete, dioxan, và tetrahydrofuran); các este (như propylen cacbonat, etyl axetat, butyl axetat, benzyl benzoat, isopropyl myristat, và các este với axit béo của propylen glycol); các nitril (như axetonitril và isobutyronitril); các amit (như dimetylformamit, dimetylaxetamit, và N-metylpyrolidon); các hydrocacbon được halogen hóa (như diclometan, tricloetan, và cacbon tetraclorea); các dầu động vật hoặc thực vật như dầu đậu nành, và dầu hạt bông; dimetyl sulfoxit, dầu silicon, axit béo cao hơn, glyxerol formal, và nước.

Các ví dụ về các chất mang dạng khí gồm có LPG (Liquefied Petroleum Gas-khí dầu mỏ hóa lỏng), không khí, khí nitơ, cacbon dioxit, và dimetyl ete.

Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt hoặc tác nhân phân tán, mà được sử dụng để thực hiện việc nhũ tương hóa, phân tán, hoặc lan truyền, gồm có các alkylsulfuat, các muối của axit alkyl (aryl) sulfonic, các

polyoxyalkylen alkyl (aryl) ete, các este của rượu polyhydric, và lignin sulfonat. Các ví dụ về các chất phụ gia được sử dụng để cải thiện các tính chất của các chế phẩm gồm có cacboxymetyl xenluloza, gom Ả rập, polyetylen glycol, và canxi stearat.

Các chất mang, các chất hoạt động bề mặt, các tác nhân phân tán, và các chất hỗ trợ nêu trên đều có thể sử dụng một mình, hoặc ở dạng kết hợp của chúng, nếu cần.

Lượng chất kiểm soát bệnh ở thực vật (hợp chất có công thức (1)) trong chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật không bị giới hạn cụ thể, và lượng thông thường là, ví dụ, 1% theo khối lượng đến 50% theo khối lượng trong trường hợp là nhũ tương, 1% theo khối lượng đến 50% theo khối lượng trong trường hợp là bột thấm ướt được, 0,1% theo khối lượng đến 30% theo khối lượng trong trường hợp là công thức bào chế dạng bột, 0,1% theo khối lượng đến 15% theo khối lượng trong trường hợp là hạt, 0,1% theo khối lượng đến 10% theo khối lượng trong trường hợp là dung dịch dầu, và 0,1% theo khối lượng đến 10% theo khối lượng trong trường hợp là sol khí

Chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật theo phương án sáng chế có thể được sử dụng trực tiếp, hoặc có thể được pha loãng để sử dụng, nếu cần.

Chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật có thể được sử dụng với các chất kiểm soát loài gây hại khác, và, ví dụ, có thể được trộn với chất gây cảm ứng kháng bệnh hoặc các chất kiểm soát loài gây hại khác để được phun, hoặc có thể được phun riêng tại các thời điểm khác nhau hoặc phun đồng thời.

Các ví dụ về các chất kiểm soát loài gây hại khác gồm có các thuốc

diệt loài gây hại, các thuốc diệt nấm, các thuốc diệt ve, các thuốc diệt cỏ, thuốc điều hòa sinh trưởng thực vật, và phân bón, và các ví dụ cụ thể của chúng gồm có các ví dụ được mô tả trong tài liệu Hướng dẫn sử dụng thuốc trừ sâu (Hướng dẫn sử dụng thuốc trừ sâu, ấn bản thứ 13, được phát hành bởi Hội đồng bảo vệ cây trồng Anh) hoặc tài liệu SHIBUYA INDEX (SHIBUYA INDEX, ấn bản thứ 13, 2008, được phát hành bởi SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP).

Các ví dụ về thuốc diệt trừ loài gây hại gồm có axephat, dichlorvos, EPN, fenitrothion, fenamifos, prothiofos, profenofos, pyraclofos, clopyrifos-metyl, clofenvinphos, demeton, ethion, malathion, coumaphos, isoxathion, fenthion, diazinon, thiodicarb, aldicarb, oxamyl, propoxur, carbaryl, fenobucarb, ethiofencarb, fenothiocarb, pirimicarb, carbofuran, carbosulfan, furathiocarb, hyquincarb, alanycarb, methomyl, benfurcarb, cartap, thioxyclam, bensultap, dicofol, tetradifon, acrinathrin, bifenthrin, xycloprothrin, xyfluthrin, dimefluthrin, empenthrin, fenfluthrin, fenpropathrin, imiprothrin, metofluthrin, permethrin, phenothrin, resmethrin, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, xypermethrin, deltamethrin, xyhalothrin, fenvalerat, fluvalinat, ethofenprox, flufenprox, halfenprox, silafluofen, xyromazin, diflubenzuron, teflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, penfluron, triflumuron, clofluazuron, diafenthiuron, methopren, fenoxycarb, pyriproxyfen, halofenozit, tebufenozit, metoxyfenozit, chromafenozit, dixyclanil, buprofezin, hexythiazox, amitraz, clodimeform, pyridaben, fenpyroxymat, flufenerim, pyrimidifen, tebufenpyrad, tolfenpyrad, fluacrypyrim, axequinoxyl, xyflumetofen, flubendiamit, ethiprol, fipronil, ethoxazol, imidacloprit, nitempyram, clothinidin, axetamiprid, dinotefuran, thiacloprit, thiamethoxam,

pymetrozin, bifenazat, spirodiclofen, spiromesifen, flonicamit, clofenapy, pyriproxyfen, indoxacarb, pyridalyl, spinosat, avermectin, milbemycin, azadirachtin, nicotin, rotenon, các tác nhân BT, các tác nhân virút gây bệnh do côn trùng, emamectin benzoat, spinetoram, pyrifluquinazon, clorantraniliprol, xyantraniliprol, xyenopyrafen, spirotetramat, lepimectin, metaflumizon, pyrafluprol, pyriprol, dimefluthrin, fenazaflor, hydrametylnon, triazamat, afidopyropen, và flupyrimin.

Các ví dụ về thuốc diệt trừ nấm gồm có: các hợp chất dựa trên strobilurin, như azoxystrobin, kresoxym-metyl, trifloxystrobin, orysastrobin, picoxystrobin, và fluoxastrobin; các hợp chất dựa trên anilino pyrimidin như mepanipyrim, pyrimetanil, và xyprodinil; các hợp chất dựa trên azol như triadimefon, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, myclobutanil, xyproconazol, tebuconazol, hexaconazol, prochloraz, và simeconazol; các hợp chất dựa trên quinoxalin như quinomethionat; các hợp chất dựa trên dithiocacbammat như maneb, zineb, mancozeb, polycacbammat, và propineb; các hợp chất dựa trên phenylcacbammat như diethofencarb; các hợp chất dựa trên clo hữu cơ như clothalonil và quintozen; các hợp chất dựa trên benzimidazol như benomyl, thiophanat-metyl, và carbendazim; các hợp chất dựa trên phenylamit như metalaxyl, oxadixyl, ofuraza, benalaxyl, furalaxyl, và xyprofuram; các hợp chất dựa trên axit sulfenic như dichlofluanit; các hợp chất dựa trên đồng như đồng hydroxit và oxin đồng; các hợp chất dựa trên isoxazol như hydroxyisoxazol; các hợp chất dựa trên phospho hữu cơ như fosetyl-nhôm và tolclofos-metyl; các hợp chất dựa trên N-halogenothioalkyl như captan, captafol, và folpet; các hợp chất dựa trên dicacboximit như proxymidon, iprodion, và vinchlozolin; các hợp chất dựa trên benzanilit như flutolanil và mepronil; các hợp chất dựa trên morpholin như fenpropimorph và

dimethomorph; các hợp chất dựa trên thiếc hữu cơ như fentin hydroxit và fentin axetat; các hợp chất dựa trên xyanopyrol như fludioxonil và fenpiclonil; các hợp chất khác như fthalit, probenazol, axibenzolar-S-metyl, tiadinil, isotianil, carpropamit, dicloxyt, fenoxanil, trioxclazol, pyroquilon, ferimzone, fluazinam, xymoxanil, triforin, pyrifenox, fenarimol, fenpropidin, penxycuron, xyazofamit, xyflufenamit, boscalit, penthiopyrad, proquinazit, quinoxifen, famoxadon, fenamidon, iprovalicarb, bentiavalicarb-isopropyl, flopicolit, pyribencarb, flutianil, isopyrazam, fenpicoxamit, kasugamyxin, và validamyxin.

Các ví dụ về các thuốc diệt ve gồm có bromopropylat, tetradifon, propargit, amitraz, fenothiocarb, hexythiazox, fenbutatin oxit, dienoclo, fenpyroximat, tebufenpyrad, pyridaben, pyrimidifen, clofentezin, etoxazol, halfenprox, milbemectin, axequinoxyl, bifenazat, fluacryprim, spiroadiclofen, spiromesifen, clofenapy, avermectin, xyenopyrafen, và xyflumetofen.

Các ví dụ về thuốc diệt cỏ gồm có: các hợp chất dựa trên axit phenoxy như xyhalofop-butyl, và 2,4-D; cacbamat-các hợp chất dựa trên như esprocarb và desmedipham; các hợp chất dựa trên axit amit như alaclo và metolaclo; các hợp chất dựa trên urea như diuron và tebuthiuron; các hợp chất dựa trên sulfonylurea như halosulfuron-metyl và flazasulfuron; các hợp chất dựa trên axit pyrimidyloxy benzoic như pyriminobac-metyl; và các hợp chất dựa trên axit amin như glyphosat, bialafos, và glufosinat (glufosinat-amoni).

Các ví dụ về thuốc điều hòa sinh trưởng thực vật gồm có: các chế phẩm của etylen như etephon; các chất auxin như axit indolebutyric và etyclozat; các xytokinin; các gibberellin; các chất đối kháng auxin; thuốc ức chế sinh trưởng thực vật; và thuốc ức chế thoát hơi nước của thực vật.

Các ví dụ về phân bón gồm có: các phân bón nitơ như urea, amoni nitrat, magiê amoni nitrat, và amoni clorua; các phân bón axit phosphoric như canxi supephosphat, amoni phosphat, magiê supephosphat, và magiê phosphat; các phân bón kali như kali clorua, kali bicacbonat, magiê–kali nitrat, kali nitrat, và kali natri nitrat; các phân bón mangan như mangan sulfat và magiê mangan nitrat; và các phân bón boro như axit boric và các muối của axit boric.

Theo phương án, sáng chế đề xuất phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật mà trong đó chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất được cho tiếp xúc với thân thực vật hoặc hạt giống, hoặc được chứa trong nền canh tác. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất có thể được sử dụng dưới dạng chế phẩm kiểm soát bệnh ở thực vật.

Trong trường hợp mà chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất được cho tiếp xúc với thân thực vật, chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất có thể được cho tiếp xúc với lá, thân, rễ, gốc ghép, rễ củ, hoặc thân củ, của thực vật, chồi giống, hoặc tương tự. Ngoài ra, chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất có thể được cho tiếp xúc với hạt giống của thực vật. Các ví dụ về nền canh tác gồm có đất, bề mặt nước của đồng lúa nơi mà lúa phát triển, các chất mang mà thực vật được cho phát triển ở trên đó, và nước thủy canh. Nước thủy canh có thể chứa các chất dinh dưỡng.

Phương pháp để cho chất kiểm soát bệnh ở thực vật nêu trên hoặc hợp chất nêu trên tiếp xúc với thân thực vật hoặc hạt giống, hoặc phương pháp làm cho chất kiểm soát bệnh ở thực vật nêu trên hoặc hợp chất nêu trên được chứa trong các nền canh tác không bị giới hạn cụ thể, miễn là phương pháp thường được sử dụng trong nông nghiệp và trồng trọt, và các ví dụ của chúng gồm có phun lá, áp dụng mặt nước, xử lý đất, áp dụng cho hộp cây giống, xử lý hạt giống, xử lý ngân, trộn với phân bón, và trộn với

nước tưới.

Lượng áp dụng của chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo phương án sáng chế có thể được xác định phụ thuộc vào loại bệnh mục tiêu, mức độ nhiễm bệnh, loại thực vật mục tiêu, và vị trí mục tiêu, trong khi xét đến phương thức áp dụng, như áp dụng phun vào không khí hoặc rắc bột cực nhỏ, ngoài phương pháp áp dụng thông thường.

Ví dụ, trong trường hợp phun chất kiểm soát bệnh ở thực vật lên lá và thân của thực vật, 1 đến 1000g chất kiểm soát bệnh ở thực vật có thể được pha loãng với 50 đến 1000L nước trên 10A (Are-một A bằng một trăm mét vuông) phải được sử dụng dưới dạng nhũ tương, bột thấm ướt được hoặc công thức bào chế có thể chảy được, hoặc 1 đến 10 kg chất kiểm soát bệnh ở thực vật có thể được sử dụng trên 10A dưới dạng bột.

Trong trường hợp mà ở đó chất kiểm soát bệnh ở thực vật được áp dụng trong đất, xấp xỉ từ 1 đến 10kg chất kiểm soát bệnh ở thực vật có thể được sử dụng trên 10A dưới dạng hạt, ví dụ.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Sau đây, sáng chế sẽ được giải thích cụ thể hơn bằng các ví dụ minh họa; tuy nhiên, phạm vi của sáng chế không bị giới hạn ở các ví dụ này.

Sau đây, các từ viết tắt được nêu dưới đây có thể được sử dụng trong các ví dụ.

ESI: Ion hóa tia điện

MS: Phổ khối lượng

IR: Phổ hấp thụ hồng ngoại

n: thông thường

tert: bậc ba

Ví dụ 1

Hòa tan axit 2,3,6-trifloisonicotinic (1,76g) vào trong N,N-dimetylformamit (10mL), tiếp theo bổ sung bromoetan (1,08g) và kali cacbonat (1,38g) vào dung dịch, và sau đó thực hiện khuấy ở 80°C trong 2 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, etyl axetat được bổ sung vào đó, hỗn hợp được đưa vào quá trình chiết tách với nước, lớp hữu cơ được làm khô với magiê sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 1-117 (hiệu suất 1,44g).

Ví dụ 2

Axit 2,3,6-trifloisonicotinic (5,28g) được hòa tan vào trong thionyl clorua (30mL), tiếp theo làm nóng hỗn hợp để hồi lưu trong 1 giờ. Sản phẩm phản ứng được cô đặc, phần cô đặc được hòa tan vào trong axetonitril (30mL), và sau đó bổ sung 3-clo-4-metylanilin (5,64g) và pyridin (3,20g) vào dung dịch, tiếp theo làm nóng hỗn hợp để hồi lưu trong 1 giờ. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, etyl axetat được bổ sung vào đó, hỗn hợp được rửa lần lượt với axit clohydric 1N và natri hydroxit 1N, lớp hữu cơ được làm khô với magiê sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 1-30 (hiệu suất 7,70g).

Ví dụ 3

Hòa tan 2,3,6-triflo-4-pyridinmetanol (106mg) vào trong diclometan (8mL), bổ sung axetyl clorua (65mg) vào dung dịch, hỗn hợp được làm nguội xuống 0°C, bổ sung N,N-diisopropyletylamin (130mg) vào hỗn hợp trên, và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Sau đó, dung môi được chưng cất đi, sản phẩm phản ứng được hòa tan vào trong

dietyl ete, dung dịch được rửa lần lượt với natri cacbonat bão hòa, axit clohydric 2%, và nước muối bão hòa, và sản phẩm phản ứng lớp hữu cơ được làm khô với magiê sulfat khan. Dung môi được chưng cất đi bằng cách sử dụng thiết bị làm bay hơi, và sau đó phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 3-1 (hiệu suất 63,2mg).

Ví dụ 4

Hòa tan axit 2,6-difloisonicotinic (50mg) được hòa tan vào trong cloroform (3,1mL), và sau đó bổ sung anilin (29 μ L), 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacodiimit hydroclorua (65mg), và 4-dimetylaminopyridin (lượng xúc tác) vào dung dịch, tiếp theo khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong 3 giờ. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và sau đó hỗn hợp được đưa vào quá trình chiết tách với etyl axetat, tiếp theo thực hiện rửa lần lượt với amoni clorua bão hòa và natri hydro cacbonat bão hòa. Lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 1-143 (hiệu suất 66,3mg).

Ví dụ 5

Hòa tan axit 2,3,6-trifloisonicotinic (30mg) vào trong cloroform (3,1mL), và sau đó etylen diamin (6,0 μ L), 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacodiimit hydroclorua (38mg), 1-hydroxybenzotriazol (27mg), và trietylamin (30 μ L) được bổ sung vào dung dịch, tiếp theo khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Bổ sung 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacodiimit hydroclorua (38mg) và 1-hydroxybenzotriazol (27mg) vào sản phẩm phản ứng lại một lần nữa, và sau đó hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 3 giờ. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và sau đó sản phẩm phản ứng được đưa

vào quá trình chiết tách với etyl axetat, tiếp theo thực hiện rửa lần lượt với amoni clorua bão hòa và natri hydro cacbonat bão hòa. Lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 1-150 (hiệu suất 20,1mg).

Ví dụ 6

Hòa tan axit 2,3,6-trifloisonicotinic (100mg) được hòa tan vào trong N,N-dimetylformamit (5,6mL), và sau đó bổ sung 2-cloetylamin hydroclorua (79mg), 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)cacbodiimit hydroclorua (128mg), 1-hydroxybenzotriazol (92mg), và trietylamin (101 μ L) vào dung dịch, tiếp theo khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong 3 giờ. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và sản phẩm phản ứng được đưa vào quá trình chiết tách với etyl axetat, tiếp theo thực hiện rửa lần lượt với amoni clorua bão hòa và natri hydro cacbonat bão hòa. Lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, dung môi được chưng cất đi, và sau đó phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu lấy N-(2-cloetyl)-2,3,6-trifloisonicotinamit (hiệu suất 100mg).

Hòa tan N-(2-cloetyl)-2,3,6-trifloisonicotinamit (20mg) thu được vào trong tetrahydrofuran (8,4mL), và sau đó 55% natri hydrua (3,8mg) được bổ sung vào dung dịch dưới điều kiện làm mát bằng đá lạnh, tiếp theo khuấy hỗn hợp trong 3 giờ. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, được đưa vào quá trình chiết tách với etyl axetat, lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký silica gel để thu được hợp chất của Ví dụ 4-2 (hiệu suất 16mg).

Ví dụ 7

Hòa tan axit 2,6-difloisonicotinic (80mg) vào trong axetonitril (1mL), và sau đó bổ sung xyclohexyl alcohol (50mg), 1-ethyl-3-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimide hydroclorua (96mg), và 4-dimethylaminopyridin (61mg) vào dung dịch, tiếp theo khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong 24 giờ. Sau đó, bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, và sau đó sản phẩm phản ứng được đưa vào quá trình chiết tách với ethyl axetat, tiếp theo thực hiện rửa lần lượt với dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hòa và dung dịch nước natri clorua bão hòa. Lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, và sau đó dung môi được chưng cất đi. Phần lỏng còn lại được tinh chế bằng sắc ký lớp mỏng điều chế (Preparative thin layer chromatography – Preparative TLC) để thu được hợp chất của Ví dụ 1-205 (hiệu suất 42mg).

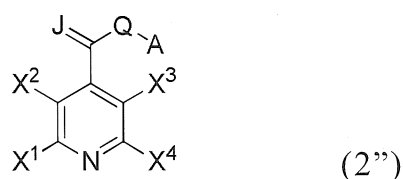
Ví dụ 8

Hòa tan axit 2,3,6-trifloisonicotinic (177 mg, 1,0 mmol) vào trong dicloetan, và sau đó bổ sung thionyl clorua (1mL) vào dung dịch, tiếp theo làm nóng hỗn hợp để hồi lưu trong 2 giờ trong khi thực hiện khuấy. Dung môi được chưng cất đi bằng cách sử dụng thiết bị làm bay hơi, và sau đó bổ sung nitrometan (3mL), 1-methylpyrrol (54 mg, 0,67 mmol), và kẽm triflometansulfonat (II) (24 mg, 0,066 mmol) vào sản phẩm phản ứng, tiếp theo khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Bổ sung natri hydro cacbonat vào hỗn hợp phản ứng, và sau đó bổ sung nước vào hỗn hợp để thực hiện chiết tách với cloroform. Lớp sản phẩm phản ứng hữu cơ được làm khô với natri sulfat khan, và dung môi được chưng cất đi bằng cách sử dụng thiết bị làm bay hơi, tiếp theo tinh chế phần lỏng còn lại bằng sắc ký silica gel (pha động: hexan / ethyl axetat = 1/1 (tỷ lệ về thể tích)), và sau đó thực hiện rửa với hexan để thu được hợp chất 2-2 (hiệu suất 44 mg, 0,18 mmol, 27% hiệu suất).

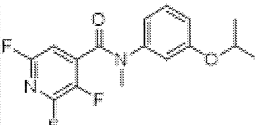
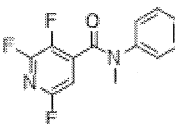
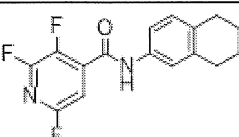
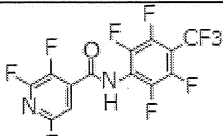
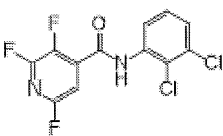
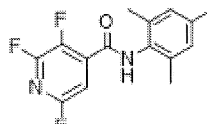
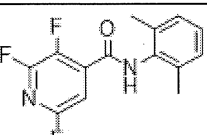
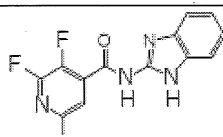
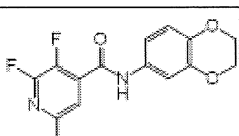
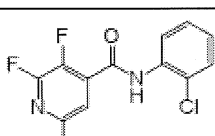
Theo phương pháp của các Ví dụ từ 1 đến 8, các hợp chất của các Ví dụ từ 1-1 đến 1-218, được biểu diễn bởi công thức (2'') và được thể hiện trong các bảng từ 13 đến 34 dưới đây, được điều chế. Ngoài ra, các hợp chất của các Ví dụ từ 2-1 đến 2-5, được biểu diễn bởi công thức (3') và được thể hiện trong bảng 35 dưới đây, được điều chế. Ngoài ra, các hợp chất của các Ví dụ từ 3-1 và 3-2, được biểu diễn bởi công thức (4') và được thể hiện trong bảng 36 dưới đây, được điều chế. Ngoài ra, các hợp chất của các Ví dụ từ 4-1 đến 4-4, được biểu diễn bởi công thức (5') và được thể hiện trong bảng 37 dưới đây, được điều chế.

Dữ liệu MS, IR, và $^1\text{H-NMR}$ của mỗi hợp chất có công thức (2''), (3'), (4') hoặc (5'), cũng như của các hợp chất đã thu được trong các Ví dụ từ 1 đến 8, được thể hiện trong các bảng từ 13 đến 37, Axeton được đetori hóa được sử dụng như dung môi để thực hiện phép đo $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, 500 MHz hoặc 600 MHz) của các hợp chất của các Ví dụ từ 1-8, 1-69, 1-175, 1-176 và 4-2, hỗn hợp của cloroform được đetori hóa và metanol được đetori hóa với tỷ lệ 1:1 được sử dụng như dung môi để thực hiện phép đo $^1\text{H-NMR}$ cho hợp chất của Ví dụ 1-93, và cloroform được đetori hóa được sử dụng như dung môi để thực hiện phép đo $^1\text{H-NMR}$ cho các hợp chất của các ví dụ khác. MS được đo bằng phương pháp ESI-MS. IR được đo bằng phương pháp KBr.

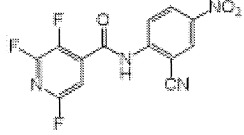
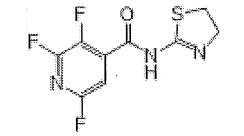
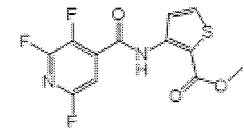
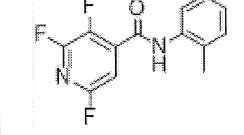
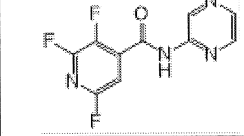
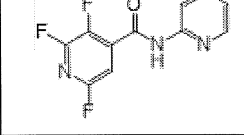
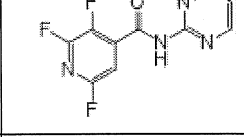
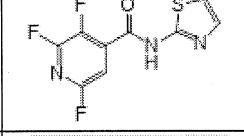
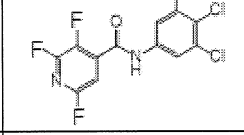
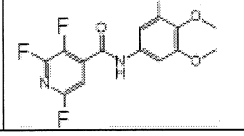
Các hợp chất của các Ví dụ 1-1 đến 1-218, được biểu diễn bởi công thức (2''), được thể hiện trong các bảng từ 13 đến 34,



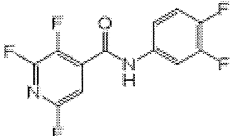
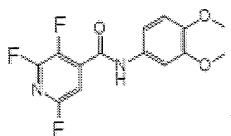
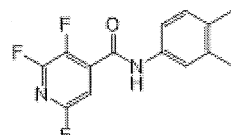
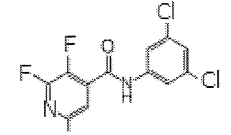
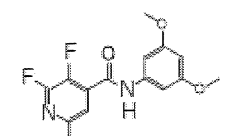
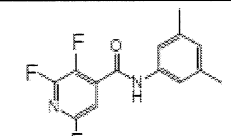
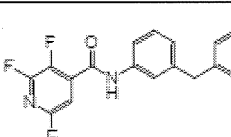
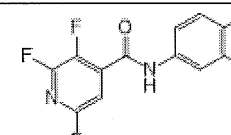
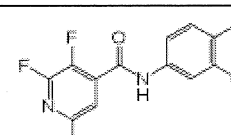
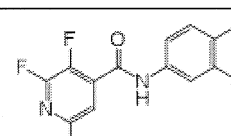
Bảng 13

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-1		1,27 (d, 6H), 3,47 (s, 3H), 4,41-4,47 (m, 1H), 6,63-6,65 (m, 2H), 6,68-6,69 (m, 1H), 6,76-6,79 (m, 1H), 7,13-7,15 (m, 1H)	$m/z = 325$ (M+H)
1-2		3,50 (3H, s), 6,70 (1H, m), 7,11 (2H, m), 7,30 (3H, m)	IR 1653, 1471, 1440, 1395, 1025, 701
1-3		1,80 (4H, m), 2,76 (4H, m), 7,07 (1H, d), 7,28 (1H, d), 7,33 (1H, m), 7,45 (1H, m), 8,17 (1H, br)	
1-4		1,60 (1H, br), 7,79 (1H, s)	$m/z = 393$ (M+H)
1-5		7,36 (2H, m), 7,56 (1H, m), 8,49 (1H, dd)	$m/z = 321$ (M+H)
1-6		2,24 (6H, s), 2,31 (3H, s), 6,97 (2H, s), 7,49 (1H, m), 7,72 (1H, br)	IR 1655, 1541, 1471, 1432, 1377, 1032
1-7		2,28 (6H, s), 7,17 (3H, m), 7,46 (1H, m), 7,80, (1H, br)	IR 1659, 1541, 1473, 1380, 1033
1-8		7,20 (2H, m), 7,32 (1H, m), 7,47 (2H, m)	$m/z = 293$ (M+H)
1-9		4,29 (4H, m), 6,88 (1H, d), 7,01 (1H, dd), 7,28 (1H, d), 7,51 (1H, m), 8,10 (1H, br)	$m/z = 311$ (M+H)
1-10		7,17 (1H, dt), 7,37 (1H, t), 7,47 (1H, dd), 7,55 (1H, m), 8,51 (1H, d), 8,99 (1H, br)	$m/z = 224$ (M+H)

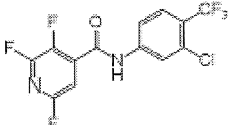
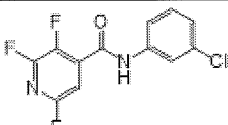
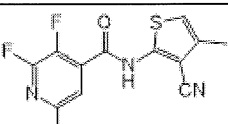
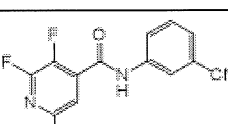
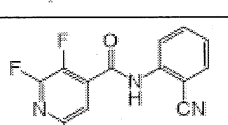
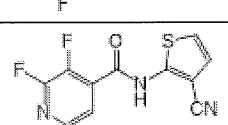
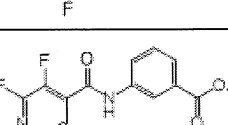
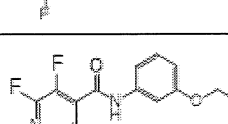
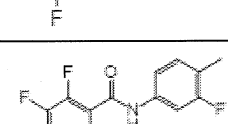
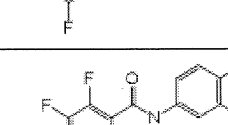
Bảng 14

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-11		7,55 (1H, m), 8,55 (2H, m), 8,89 (1H, d), 9,19 (1H, br)	$m/z = 323$ (M+H)
1-12		3,94 (2H, t), 3,40 (2H, t), 7,32 (1H, m)	$m/z = 262$ (M+H)
1-13		3,95 (3H, s), 7,49 (1H, m), 7,57 (1H, d), 8,23 (1H, d), 11,37 (1H, br)	$m/z = 317$ (M+H)
1-14		2,36 (3H, s), 7,19 (1H, t), 7,30 (2H, m), 7,56 (1H, m), 8,01 (1H, d)	IR 1655, 1546, 1459, 1370, 1033
1-15		7,53 (1H, m), 8,36 (1H, t), 8,49 (1H, d), 8,82 (1H, br), 9,65 (1H, d)	$m/z = 255$ (M+H)
1-16		7,17 (1H, dd), 7,49 (1H, m), 7,81 (1H, dt), 8,30 (1H, d), 8,37 (1H, d)	$m/z = 254$ (M+H)
1-17		7,15 (1H, t), 7,42 (1H, m), 8,68 (1H, d), 8,85 (1H, br)	$m/z = 255$ (M+H)
1-18		7,14 (1H, d), 7,50 (1H, d), 7,53 (1H, m)	$m/z = 260$ (M+H)
1-19		7,50 (1H, m), 7,78 (2H, s), 8,21 (1H, br)	$m/z = 355$ (M+H)
1-20		3,85 (s, 3H), 3,90 (s, 6H), 6,93 (s, 2H), 7,49-7,50 (m, 1H), 8,19-8,22 (m, 1H)	$m/z = 343$ (M+H)

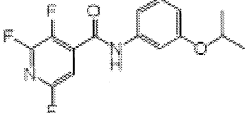
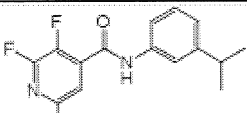
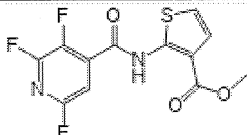
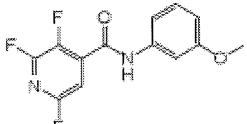
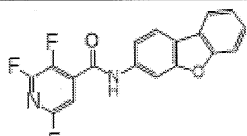
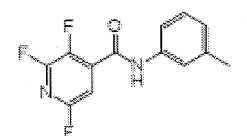
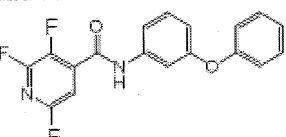
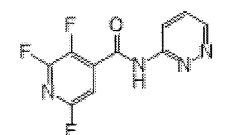
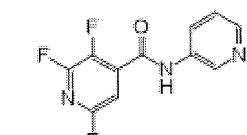
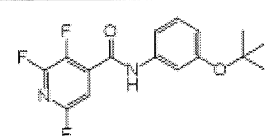
Bảng 15

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-21		7,21 (2H, m), 7,50 (1H, m), 7,74 (1H, m)	$m/z = 289$ (M+H)
1-22		3,91 (3H, s), 3,93 (3H, s), 6,88 (1H, d), 7,05 (1H, dd), 7,39 (1H, d), 7,51 (1H, m), 8,19 (1H, br)	$m/z = 313$ (M+H)
1-23		2,27 (3H, s), 2,29 (3H, s), 7,16 (1H, d), 7,36 (1H, dd), 7,40 (1H, d), 7,51 (1H, m), 8,13 (1H, br)	$m/z = 281$ (M+H)
1-24		7,23 (1H, s), 7,49 (1H, m), 7,60 (1H, s), 8,20 (1H, br)	$m/z = 321$ (M+H)
1-25		3,82 (6H, s), 6,35 (1H, t), 6,85 (2H, d), 7,49 (1H, m), 8,16 (1H, br)	$m/z = 313$ (M+H)
1-26		2,35 (6H, s), 6,89 (1H, s), 7,26 (2H, s), 7,51 (1H, m), 8,13 (1H, br)	$m/z = 281$ (M+H)
1-27		4,01 (2H, s), 7,08 (1H, d), 7,20 (2H, d), 7,24-7,35 (4H, m), 7,43 (1H, s), 7,51 (2H, m)	$m/z = 343$ (M+H)
1-28		2,41 (3H, s), 7,26 (1H, m), 7,46 (1H, dd), 7,51 (1H, m), 7,91 (1H, d), 8,17 (1H, br)	$m/z = 345$ (M+H)
1-29		7,19 (1H, t), 7,45 (1H, m), 7,51 (1H, m), 7,85 (1H, dd), 8,21 (1H, br)	$m/z = 305$ (M+H)
1-30		2,40 (3H, s), 7,27 (1H, d), 7,40 (1H, dd), 7,53 (1H, m), 7,77 (1H, d)	$m/z = 301$ (M+H)

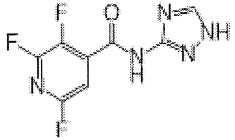
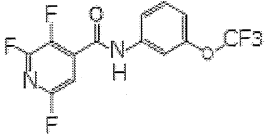
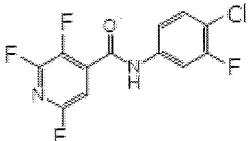
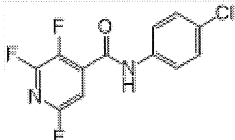
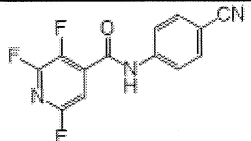
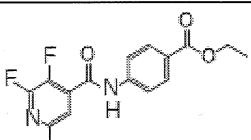
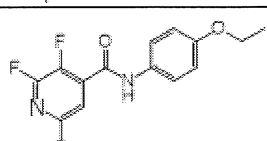
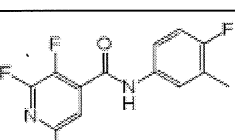
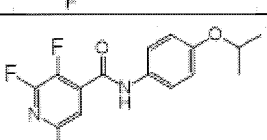
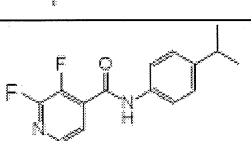
Bảng 16

Vi dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-31		7,51 (1H, m), 7,61 (1H, d), 7,73 (1H, d), 7,95 (1H, s), 8,34 (1H, br)	$m/z = 355$ (M+H)
1-32		7,24 (1H, dt), 7,34 (1H, t), 7,46 (1H, dd), 7,51 (1H, m), 7,78 (1H, dd), 8,21 (1H, br)	$m/z = 287$ (M+H)
1-33		2,36 (3H, s), 6,67 (1H, s), 7,54 (1H, m), 9,46 (1H, br)	$m/z = 284$ (M+H)
1-34		7,53 (3H, m), 7,79 (1H, m), 8,10 (1H, s), 8,29 (1H, br)	$m/z = 278$ (M+H)
1-35		7,33 (1H, t), 7,47 (1H, m), 7,71 (2H, m), 8,51 (1H, d), 8,86 (1H, br)	$m/z = 278$ (M+H)
1-36		7,06 (1H, d), 7,10 (1H, d), 7,54 (1H, m), 9,54 (1H, br)	$m/z = 283$ (M+H)
1-37		1,42 (3H, t), 4,41 (2H, q), 7,51 (2H, m), 7,92 (1H, d), 8,01 (1H, d), 8,14 (1H, s), 8,31 (1H, br)	$m/z = 325$ (M+H)
1-38		1,44 (3H, t), 4,07 (2H, q), 6,77 (1H, dd), 7,10 (1H, dd), 7,30 (1H, t), 7,36 (1H, t), 7,51 (1H, m), 8,20 (1H, br)	$m/z = 297$ (M+H)
1-39		2,28 (3H, s), 7,17 (1H, dd), 7,20 (1H, t), 7,51 (1H, m), 7,55 (1H, dd), 8,20 (1H, br)	$m/z = 285$ (M+H)
1-40		2,44 (3H, s), 7,26 (1H, m), 7,50 (1H, m), 7,53 (1H, dd), 8,11 (1H, d), 8,14 (1H, br)	$m/z = 393$ (M+H)

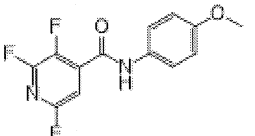
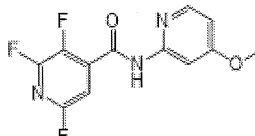
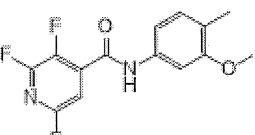
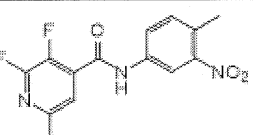
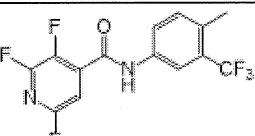
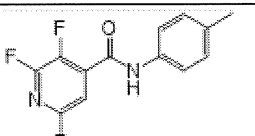
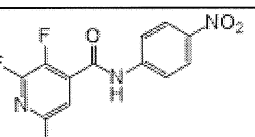
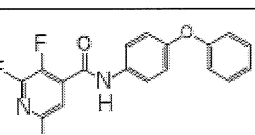
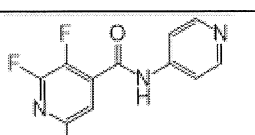
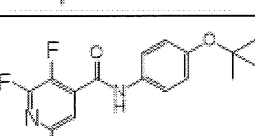
Bảng 17

Vi dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-41		1,37 (6H, d), 4,59 (1H, sep), 6,76 (1H, dd), 7,08 (1H, dd), 7,28 (1H, t), 7,34 (1H, dd), 7,50 (1H, m), 8,19 (1H, br)	m/z = 311 (M+H)
1-42		1,28 (6H, d), 2,95 (1H, sep), 7,12 (1H, d), 7,34 (1H, t), 7,48 (2H, m), 7,51 (1H, m)	m/z = 295 (M+H)
1-43		3,96 (3H, s), 6,92 (1H, d), 7,32 (1H, d), 7,56 (1H, m)	m/z = 317 (M+H)
1-44		3,85 (3H, s), 6,79 (1H, m), 7,11 (1H, d), 7,29 (1H, t), 7,38 (1H, m), 7,51 (1H, m)	m/z = 283 (M+H)
1-45		7,35 (1H, t), 7,39 (1H, dd), 7,46 (1H, t), 7,54 (1H, m), 7,58 (1H, d), 7,93 (2H, m), 8,20 (1H, d), 8,50 (1H, br)	m/z = 343 (M+H)
1-46		2,40 (3H, s), 7,06 (1H, d), 7,30 (1H, t), 7,42 (1H, d), 7,47 (1H, m), 7,51 (1H, s)	m/z = 267 (M+H)
1-47		6,88 (1H, m), 7,05 (2H, m), 7,15 (1H, m), 7,36 (5H, m), 7,49 (1H, m), 8,20 (1H, br)	m/z = 345 (M+H)
1-48		7,47 (1H, m), 7,61 (1H, dd), 8,58 (1H, d), 9,04 (1H, d)	m/z = 255 (M+H)
1-49		7,43 (1H, dd), 7,52 (1H, m), 8,28 (1H, dd), 8,35 (1H, br), 8,50 (1H, m), 8,78 (1H, m)	m/z = 254 (M+H)
1-50		1,39 (9H, s), 6,89 (1H, m), 7,30 (2H, m), 7,39 (1H, m), 7,52 (1H, m)	m/z = 325 (M+H)

Bảng 18

Vi dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-51		7,25-7,27 (m, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,84 (m, 1H)	m/z = 244 (M+H)
1-52		7,11 (1H, d), 7,41-7,51 (3H, m), 7,71 (1H, s), 8,34 (1H br)	m/z = 337 (M+H)
1-53		7,23 (1H, m), 7,42 (1H, m), 7,50 (1H, m), 7,75 (1H, m), 8,27 (1H, br)	m/z = 305 (M+H)
1-54		7,38 (2H, d), 7,50 (1H, m), 7,60 (1H, d), 8,21 (1H, br)	m/z = 287 (M+H)
1-55		7,52 (1H, m), 7,72 (2H, d), 7,80 (2H, d), 8,37 (1H, br)	m/z = 278 (M+H)
1-56		1,41 (3H, t), 4,40 (2H, q), 7,52 (1H, m), 7,73 (2H, d), 8,10 (2H, d), 8,35 (1H, br)	m/z = 325 (M+H)
1-57		1,43 (3H, t), 4,05 (2H, q), 6,92 (2H, m), 7,52 (3H, m)	m/z = 297 (M+H)
1-58		2,31 (3H, s), 7,04 (1H, m), 7,39 (1H, m), 7,49 (2H, m), 8,16 (1H, br)	m/z = 285 (M+H)
1-59		1,34 (6H, d), 4,55 (1H, sep), 6,92 (2H, d), 7,53 (3H, m), 8,14 (1H, br)	m/z = 311 (M+H)
1-60		1,26 (6H, d), 2,93 (1H, sep), 7,28 (2H, d), 7,54 (3H, m)	m/z = 295 (M+H)

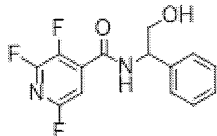
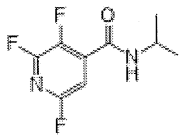
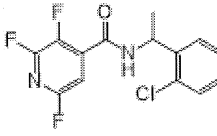
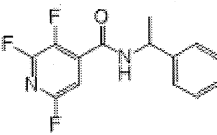
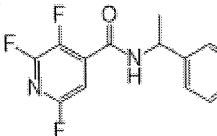
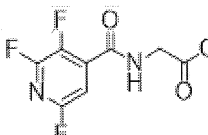
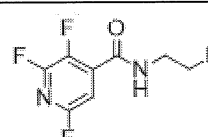
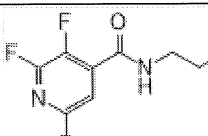
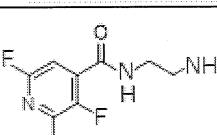
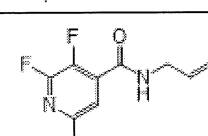
Bảng 19

Vi dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-61		3,83 (3H, s), 6,94 (2H, d), 7,51 (1H, m), 7,54 (2H, d)	m/z = 283 (M+H)
1-62		3,93 (3H, s), 6,70 (1H, m), 7,45 (1H, m), 7,91 (1H, s), 8,14 (1H, d), 8,86 (1H, br)	m/z = 284 (M+H)
1-63		2,21 (1H, s), 3,88 (1H, s), 6,93 (1H, d), 7,13 (1H, d), 7,38 (1H, s), 7,51 (1H, m), 8,19 (1H, br)	m/z = 297 (M+H)
1-64		2,62 (3H, s), 7,40 (1H, d), 7,52 (1H, m), 7,81 (1H, dd), 8,32 (1H, d), 8,35 (1H, br)	m/z = 312 (M+H)
1-65		2,49 (3H, s), 7,34 (1H, d), 7,52 (1H, m), 7,75 (1H, dd), 7,85 (1H, d), 8,26 (1H, br)	m/z = 335 (M+H)
1-66		2,37 (3H, s), 7,21 (2H, d), 7,51 (3H, m), 8,17 (1H, br)	m/z = 267 (M+H)
1-67		7,53 (1H, m), 7,85 (2H, d), 8,31 (2H, d), 8,48 (1H, br)	m/z = 298 (M+H)
1-68		7,04 (4H, m), 7,13 (1H, m), 7,35 (2H, m), 7,52 (1H, m), 7,60 (2H, m)	m/z = 345 (M+H)
1-69		7,44 (1H, m), 7,70 (2H, d), 8,53 (2H, d), 10,36 (1H, br)	m/z = 254 (M+H)
1-70		1,36 (9H, s), 7,04 (2H, d), 7,53 (3H, m)	m/z = 325 (M+H)

Bảng 20

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-71		1,33 (s, 9H), 7,42-7,56 (m, 5H), 8,15-8,23 (m, 1H)	m/z = 309 (M+H)
1-72		7,27 (2H, m), 7,51 (1H, m), 7,68 (2H, m), 8,26 (1H, br)	m/z = 337 (M+H)
1-73		2,47 (3H, s), 6,79 (1H, s), 7,46 (1H, m)	m/z = 258 (M+H)
1-74		2,46 (3H, s), 7,12 (1H, s), 7,48 (1H, m)	m/z = 274 (M+H)
1-75		4,68 (2H, d), 7,32-7,40 (5H, m), 7,46 (1H, m)	m/z = 267 (M+H)
1-76		1,48 (s, 9H), 6,39 (br s, 1H), 7,37 (t, J=2,9Hz, 1H)	
1-77		3,65-3,68 (m, 2H), 3,85-3,86 (m, 2H), 4,04 (s, 3H), 7,01 (t, J=2,8Hz, 1H), 7,09 (br s, 1H)	
1-78		1,92 (1H, br), 3,69 (2H, m), 3,87 (2H, br), 7,43 (1H, m)	m/z = 221 (M+H)
1-79		1,64 (bs, 1H), 2,79-2,84 (m, 2H), 3,67-3,72 (M, 2H), 7,05 (br s, 1H), 7,42-7,44 (m, 1H)	
1-80		4,68 (2H, d), 7,32-7,40 (5H, m), 7,46 (1H, m)	m/z = 267 (M+H)

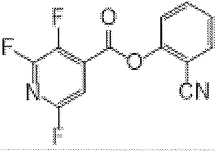
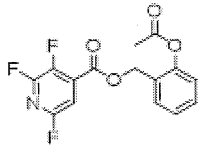
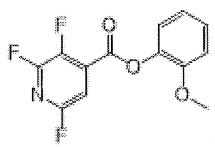
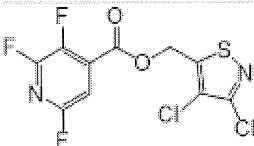
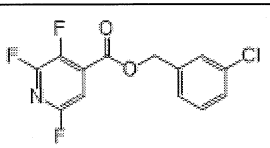
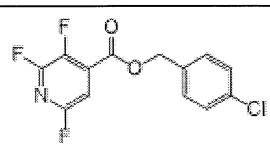
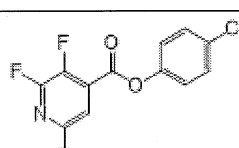
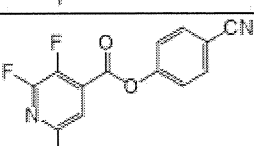
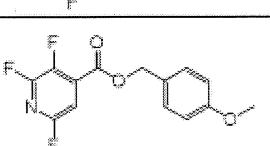
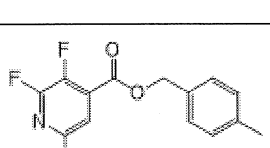
Bảng 21

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-81		4,00 (2H, m), 5,30 (1H, m), 7,33-7,43 (6H, m)	IR 1654, 1542, 1466, 1437, 1383, 1053, 1030, 754
1-82		1,29 (6H, d), 4,30 (1H, dsep), 6,40 (1H, br), 7,42 (1H, m)	
1-83		1,62 (3H, d), 5,53 (1H, m), 7,02 (1H, br), 7,27 (1H, dd), 7,30 (1H, d), 7,39 (1H, m), 7,42 (1H, d)	m/z = 349 (M+H)
1-84		1,63 (3H, d), 5,30 (1H, m), 6,81 (1H, br), 7,32 (2H, m), 7,37 (2H, m), 7,42 (1H, m)	m/z = 315 (M+H)
1-85		1,65 (3H, d), 5,34 (1H, m), 6,84 (1H, br), 7,31-7,44 (6H, m)	m/z = 281 (M+H)
1-86		3,81 (3H, s), 4,28 (2H, d), 7,42 (1H, m)	IR 1747, 1655, 1553, 1466, 1428, 1383, 1218, 1032, 771
1-87		3,60 (2H, m), 3,92 (2H, m), 7,12 (1H, br), 7,40 (1H, m)	IR 3295, 1742, 1663, 1636, 1543, 1470, 1429, 1375, 1359, 1032, 1013
1-88		1,00 (3H, t), 1,68 (2H, sext), 3,48 (2H, m), 7,43 (1H, m)	m/z = 219 (M+H)
1-89		1,43(9H, s), 3,41(2H, dd), 3,60(2H, dd), 4,91(1H, br), 7,36(1H, s), 7,52(1H, br)	m/z = 320 (M+H)
1-90		4,14 (2H, m), 5,25-5,32 (2H, m), 5,93 (1H, m), 6,67 (1H, br), 7,44 (1H, m)	m/z = 217 (M+H)

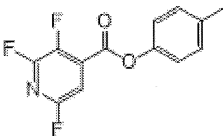
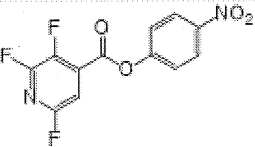
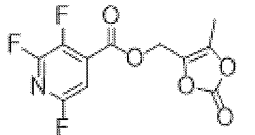
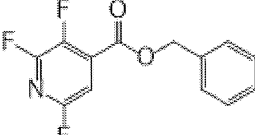
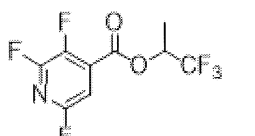
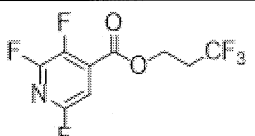
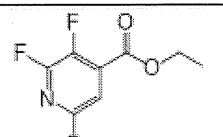
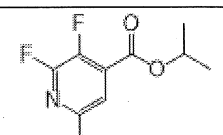
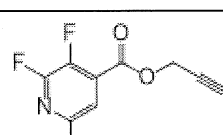
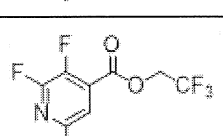
Bảng 22

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-91		4,43(2H, d), 6,99(1H, br), 7,48(1H, s)	
1-92		3,08 (3H, d), 6,65 (1H, br), 7,45 (1H, m)	$m/z = 191$ (M+H)
1-93		7,06 (1H, m), 7,61 (2H, m), 7,70 (1H, m), 8,10 (2H, m)	IR 1712, 1634, 1465, 1453, 1375, 1197, 1167, 851, 541
1-94		1,26 (3H, m), 1,43 (2H, m), 1,65 (1H, m), 1,77 (2H, m), 2,02 (2H, m), 4,00 (1H, m), 6,44 (1H, br), 7,42 (1H, m)	$m/z = 259$ (M+H)
1-95		0,68 (2H, m), 0,95 (2H, m), 2,95 (1H, m), 6,69 (1H, br), 7,44 (1H, m)	$m/z = 217$ (M+H)
1-96		0,88 (3H, t), 1,27-1,38 (10H, m), 1,64 (2H, m), 3,48 (2H, m), 6,95 (1H, br), 7,43 (1H, m)	$m/z = 289$ (M+H)
1-97		3,87 (3H, s), 7,40 (1H, m), 9,12 (1H, br)	$m/z = 207$ (M+H)
1-98		7,25 (1H, m), 7,42 (2H, m), 7,52 (1H, m), 7,64 (2H, d), 8,23 (1H br)	$m/z = 253$ (M+H)
1-99		4,57(2H, s), 7,31(4H, m), 7,39(1H, s), 7,41(1H, s), 7,48(1H, d), 7,76(1H, m), 7,85(1H, s)	$m/z = 420$ (M+H)
1-100		5,53 (2H, s), 7,33 (3H, m), 7,44 (1H, d), 7,51 (1H, d)	$m/z = 302$ (M+H)

Bảng 23

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-101		7,47-7,51 (3H, m), 7,74 (1H, dt), 7,77 (1H, dd)	$m/z = 279$ (M+H)
1-102		2,34 (s, 3H), 5,40 (s, 2H), 7,15 (d, J=8,3Hz, 1H), 7,25-7,26 (m, 1H), 7,28-7,31 (m, 1H), 7,42-7,44 (m, 1H), 7,53-7,54 (m, 1H)	
1-103		3,85 (3H, s), 7,02 (2H, m), 7,16 (1H, dd), 7,29 (1H, m), 7,45 (1H, m)	$m/z = 283$ (M+H)
1-104		5,61 (2H, s), 7,32 (1H, m)	$m/z = 341$ (M+H)
1-105		5,39 (2H, s), 7,29-7,37 (4H, m), 7,43 (1H, s)	$m/z = 302$ (M+H)
1-106		5,39 (2H, s), 7,28 (1H, m), 7,39 (4H, m)	$m/z = 302$ (M+H)
1-107		7,19 (2H, m), 7,44 (3H, m)	$m/z = 288$ (M+H)
1-108		7,43 (3H, m), 7,79 (2H, dd)	$m/z = 279$ (M+H)
1-109		3,82 (3H, s), 5,36 (2H, s), 6,93 (2H, d), 7,26 (1H, m), 7,38 (2H, d)	$m/z = 298$ (M+H)
1-110		2,36 (3H, s), 5,38 (2H, s), 7,21 (2H, d), 7,26 (1H, m), 7,33 (2H, d)	$m/z = 282$ (M+H)

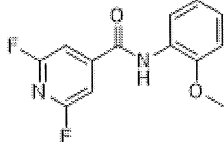
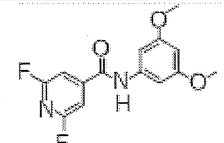
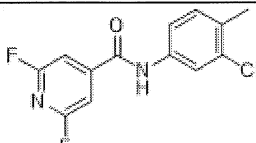
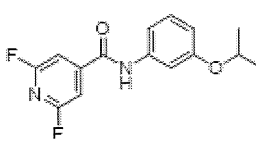
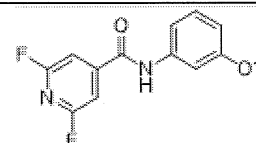
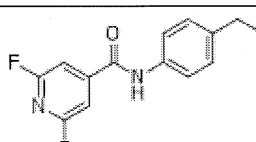
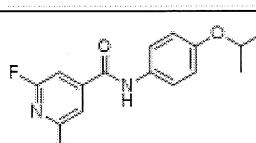
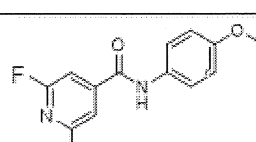
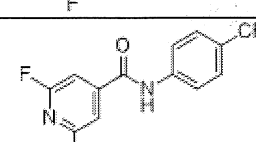
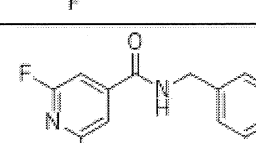
Bảng 24

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-111		2,39 (3H, s), 7,11 (2H, dd), 7,25 (2H, dd), 7,42 (1H, m)	m/z = 268 (M+H)
1-112		7,46 (3H, m), 8,37 (2H, m)	m/z = 299 (M+H)
1-113		2,24 (3H, s), 5,14 (2H, s), 7,29 (1H, m)	IR 1825, 1746, 1634, 1474, 1365, 1230, 1031, 770
1-114		5,41 (2H, s), 7,28 (1H, m), 7,37-7,46 (5H, m)	m/z = 268 (M+H)
1-115		1,57 (d, J= 6,9Hz, 3H), 5,53-5,58 (m, 1H), 7,29-7,30 (m, 1H)	
1-116		2,60-2,68 (m, 2H), 4,63 (t, J=6,3 Hz, 2H), 7,27 (t, J=2,8 Hz, 1H)	
1-117		1,43 (3H, t), 4,47 (2H, q), 7,27 (1H, m)	m/z = 206 (M+H)
1-118		1,40 (6H, d), 5,30 (1H, sep), 7,25 (1H, m)	m/z = 220 (M+H)
1-119		2,59 (1H, t), 4,99 (2H, d), 7,33 (1H, m)	m/z = 216 (M+H)
1-120		4,76-4,79 (m, 2H), 7,31-7,32 (m, 1H)	

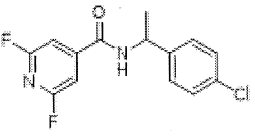
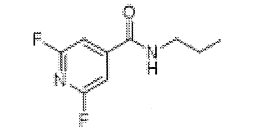
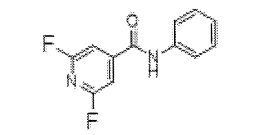
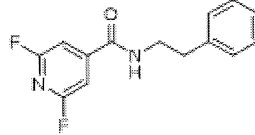
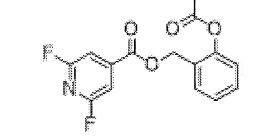
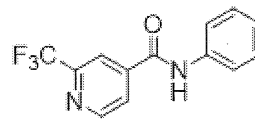
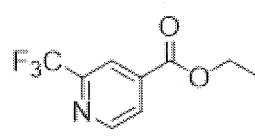
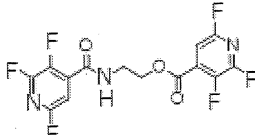
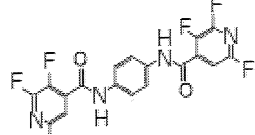
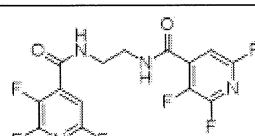
Bảng 25

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-121		1,03 (6H, d), 2,09 (1H, m), 4,19 (2H, d), 7,28 (1H, m)	IR 1732, 1472, 1439, 1384, 1366, 1276, 1256, 1034, 992, 758
1-122		4,99 (2H, d), 6,18 (1H, t), 7,29 (1H, m)	IR 1740, 1437, 1439, 1387, 1361, 1250, 1207, 1035, 878
1-123		1,03 (3H, t), 1,81 (2H, sext), 4,37 (2H, t), 7,28 (1H, m)	$m/z = 220$ (M+H)
1-124		5,06 (2H, d), 6,36 (1H, dt), 6,79 (1H, d), 7,29-7,34 (4H, m), 7,42 (2H, m)	$m/z = 294$ (M+H)
1-125		1,32 (3H, t), 4,28 (2H, q), 4,91 (2H, s), 7,35 (1H, m)	$m/z = 264$ (M+H)
1-126		4,01 (3H, s), 7,29 (1H, m),	$m/z = 192$ (M+H)
1-127		0,88 (3H, m), 1,27-1,39 (8H, m), 1,66 (2H, m), 1,77 (2H, m), 4,39 (2H, t), 7,28 (1H, m)	$m/z = 290$ (M+H)
1-128		4,90 (2H, d), 5,37 (1H, dd), 5,43 (1H, dd), 6,01 (1H, m), 7,30 (1H, m)	$m/z = 218$ (M+H)
1-129		7,24 (2H, d), 7,34 (1H, t), 7,43-7,48 (3H, m)	$m/z = 254$ (M+H)
1-130		7,22 (1H, m), 7,52 (5H, m)	$m/z = 270$ (M+H)

Bảng 26

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-131		3,96(3H, s), 6,95(1H, dd), 7,04(1H, td), 7,15(1H, td), 8,46(2H, m)	$m/z = 265$ (M+H)
1-132		3,81(6H, s), 6,34(1H, t), 6,84(2H, s), 7,24(2H, s), 7,67(1H, br)	$m/z = 295$ (M+H)
1-133		2,37(3H, s), 7,24(2H, s), 7,37(1H, m), 7,71(2H, m)	$m/z = 283$ (M+H)
1-134		1,36(6H, d), 4,58(1H, tt), 6,76(1H, m), 7,05(1H, m), 7,27(3H, m), 7,33(1H, s), 7,74(1H, br)	$m/z = 293$ (M+H)
1-135		3,84(3H, s), 6,77(1H, m), 7,10(1H, m), 7,25(2H, s), 7,30(1H, t), 7,35(1H, br), 7,77(1H, br)	$m/z = 265$ (M+H)
1-136		1,25(3H, t), 2,66(2H, q), 7,22(2H, s), 7,25(2H, s), 7,51(2H, d), 7,69(1H, br)	$m/z = 263$ (M+H)
1-137		1,34(6H, d), 4,54(1H, m), 6,91(2H, m), 7,24(2H, s), 7,49(2H, d), 7,66(1H, s)	$m/z = 293$ (M+H)
1-138		3,83(3H, s), 6,93(2H, m), 7,25(2H, d), 7,51(2H, d), 7,69(1H, br)	$m/z = 265$ (M+H)
1-139		7,27(2H, s), 7,53(2H, m), 7,85(1H, d), 7,93(2H, m)	$m/z = 303$ (M+H)
1-140		4,64(2H, d), 6,36(1H, br), 7,16(2H, s), 7,28(5H, m)	$m/z = 249$ (M+H)

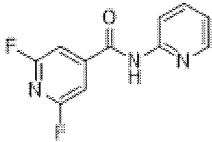
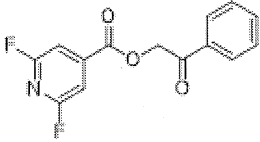
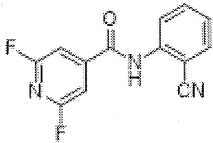
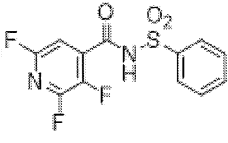
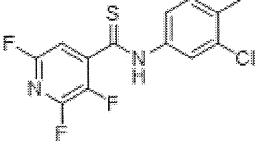
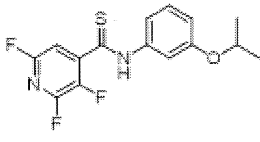
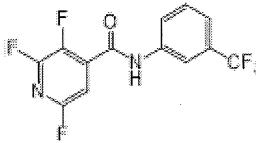
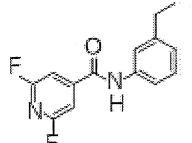
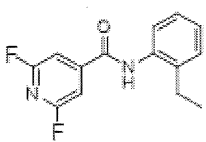
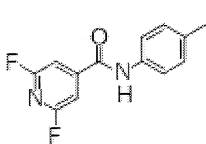
Bảng 27

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-141		1,61(3H, d), 5,27(1H, m), 6,26(1H, br), 7,13(2H, s), 7,33(4H, m)	m/z = 297 (M+H)
1-142		1,00(3H, t), 1,67(2H, td), 3,44(2H, q), 6,11(1H, br), 7,14(2H, s)	m/z = 201 (M+H)
1-143		7,21(3H, m), 7,41(2H, m), 7,61(2H, d)	m/z = 234 (M+H)
1-144		2,95(2H, t), 3,74(2H, dd), 6,07(1H, br), 7,03(2H, s), 7,26(3H, m), 7,37(2H, m)	m/z = 263 (M+H)
1-145		2,32 (s, 3H), 5,38 (s, 2H), 7,15 (d, J=8,2Hz, 1H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,44 (t, J=7,7Hz, 1H), 7,51 (d, J=7,4Hz, 1H)	
1-146		7,21-7,26 (m, 1H), 7,39-7,43 (m, 2H), 7,62-7,64 (m, 2H), 7,91-7,95 (m, 2H), 8,10 (s, 1H), 8,90-8,92 (m, 1H)	
1-147		1,44 (t, 3H), 4,47 (q, 2H), 8,06-8,07 (m, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,90 (m, 1H)	
1-148		3,92-3,96 (m, 2H), 4,61-4,64 (m, 2H), 7,00 (br s, 1H), 7,30-7,32 (m, 1H), 7,43 (s, 1H)	
1-149		7,52 (2H, m), 7,72 (4H, s)	m/z = 427 (M+H)
1-150		2,83(2H, m), 3,69(2H, m), 7,30(2H, m), 8,06(1H, br)	m/z = 379 (M+H)

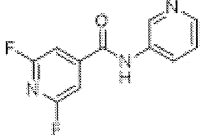
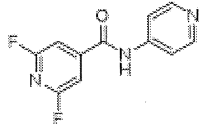
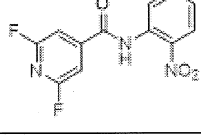
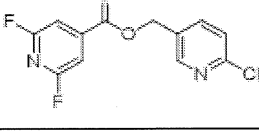
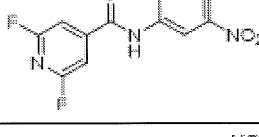
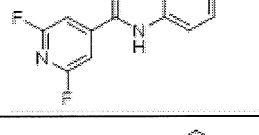
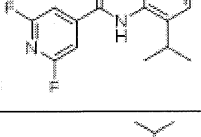
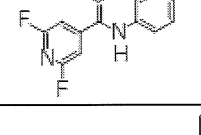
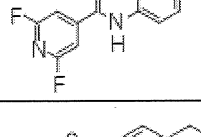
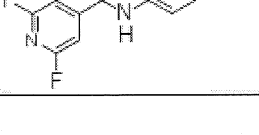
Bảng 28

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-151		5,10 (4H, d), 6,00 (2H, t), 7,31 (2H, m)	m/z = 407 (M+H)
1-152		4,97 (4H, d), 6,11 (2H, t), 7,32 (2H, m)	m/z = 407 (M+H)
1-153		7,25 (m, 2H), 7,36-7,40 (m, 2H), 7,57-7,59 (m, 2H), 7,72 (br s, 1H)	m/z = 267 (M-H)
1-154		7,16-7,27 (m, 5H), 7,97 (br s, 1H), 8,38 (t, J=7,8Hz, 1H)	m/z = 251 (M-H)
1-155		7,24 (m, 2H), 7,43-7,49 (m, 2H), 7,72 (br s, 1H), 7,88 (d, J=2,1Hz, 1H)	m/z = 301 (M-H)
1-156		1,33 (s, 9H), 7,25 (m, 2H), 7,41-7,44 (m, 2H), 7,52-7,54 (m, 2H), 7,69 (br s, 1H)	m/z = 291 (M+H)
1-157		1,31 (s, 9H), 7,17-7,23 (m, 4H), 7,89 (br s, 1H), 8,24 (t, J=8,4Hz, 1H)	m/z = 309 (M+H)
1-158		1,29 (d, J=6,6Hz, 6H), 4,23-4,32 (m, 1H), 5,88 (br s, 1H), 7,13 (s, 2H)	m/z = 201 (M+H)
1-159		4,08-4,12 (m, 2H), 5,24-5,32 (m, 2H), 5,87-5,97 (m, 1H), 6,16 (br s, 1H), 7,16 (s, 2H)	m/z = 199 (M+H)
1-160		2,34 (t, J=2,6Hz, 1H), 4,26-4,28 (m, 2H), 6,29 (br s, 1H), 7,17 (s, 2H)	m/z = 197 (M+H)

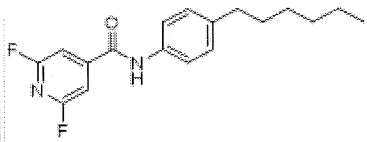
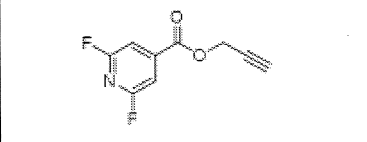
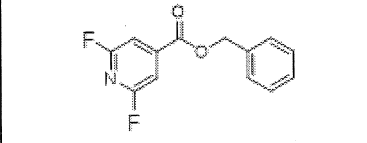
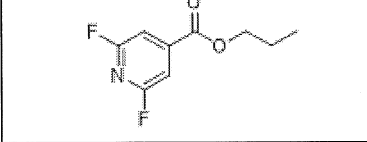
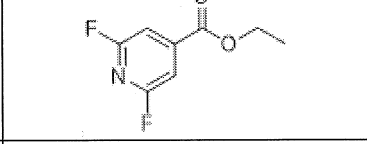
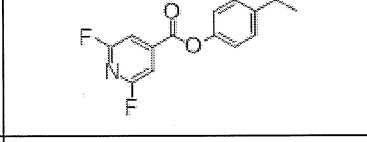
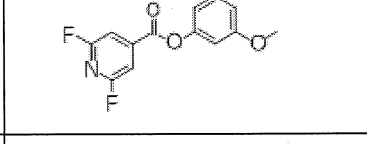
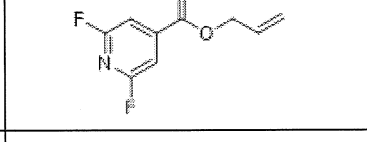
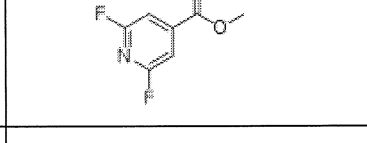
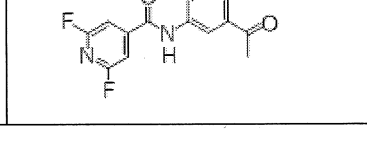
Bảng 29

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
1-161		7,14-7,18 (m, 1H), 7,31 (m, 2H), 7,79-7,83 (m, 1H), 8,31-8,34 (m, 2H), 8,54 (br s, 1H)	m/z = 236 (M+H)
1-162		5,64 (s, 2H), 7,50 (m, 2H), 7,52-7,56 (m, 2H), 7,64-7,69 (m, 1H), 7,94-7,97 (m, 2H)	m/z = 278 (M+H)
1-163		7,31-7,35 (m, 3H), 7,68-7,73 (m, 2H), 8,25 (br s, 1H), 8,50 (d, J=8,4Hz, 1H)	m/z = 258 (M+H)
1-164		7,13-7,14 (m, 1H), 7,53-7,56 (m, 2H), 7,66-7,68 (m, 1H), 7,87-7,89 (m, 2H), 9,33 (br s, 1H)	
1-165		2,41 (s, 3H), 7,31-7,36 (m, 2H), 7,50-7,52 (m, 1H), 7,83-7,84 (m, 1H), 9,04 (br s, 1H)	m/z = 315.01(M+H)
1-166		1,37 (d, J=6,1Hz, 6H), 4,55-4,60 (m, 1H), 6,87-6,89 (m, 1H), 7,13-7,17 (m, 1H), 7,32-7,36 (m, 2H), 7,57-7,58 (m, 1H), 9,06 (br s, 1H)	m/z = 325.07(M+H)
1-167		7,50 (m, 3H), 7,82-7,84 (m, 1H), 7,96 (s, 1H), 8,31-8,33 (m, 1H)	
1-168		1,26 (3H, t), 2,68 (2H, q), 7,06-7,08 (1H, m), 7,25-7,34 (3H, m), 7,42-7,46 (2H, m), 7,70 (1H, br s)	m/z = 263 (M+H)
1-169		1,29 (3H, t), 2,67 (2H, q), 7,22-7,31 (5H, m), 7,83 (1H, br s), 7,83-7,84 (1H, m)	m/z = 263 (M+H)
1-170		2,36 (3H, s), 7,20-7,26 (4H, m), 7,48-7,52 (2H, m), 7,68 (1H, br s)	m/z = 247 (M+H)

Bảng 30

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-171		7,26-7,28 (2H, m), 7,37-7,40 (1H, m), 7,91 (1H, br s), 8,24-8,26 (1H, m), 8,47-8,48 (1H, m), 8,70-8,71 (1H, m)	m/z = 234 (M+H)
1-172		7,27 (2H, m), 7,59-7,61 (2H, m), 7,97 (1H, br s), 8,61-8,62 (2H, m)	m/z = 234 (M+H)
1-173		7,32-7,36 (3H, m), 7,76-7,80 (1H, m), 8,32-8,35 (1H, m), 8,91-8,94 (1H, m), 11,43 (1H, br s)	m/z = 278 (M+H)
1-174		5,40 (2H, s), 7,26-7,41 (4H, m), 7,74-7,77 (1H, m), 8,50 (1H, m)	m/z = 285 (M+H)
1-175		7,65 (2H, m), 7,71-7,76 (1H, m), 8,07-8,10 (1H, m), 8,24-8,27 (1H, m), 8,83-8,85 (1H, m), 10,25 (1H, br s)	m/z = 278 (M+H)
1-176		7,64 (2H, s), 8,10-8,14 (2H, m), 8,31-8,35 (2H, m), 10,33 (1H, br s)	m/z = 278 (M+H)
1-177		1,29 (6H, d, J=6,85Hz), 3,01-3,08 (1H, m), 7,26-7,32 (4H, m), 7,36-7,38 (1H, m), 7,66-7,70 (2H, m)	m/z = 277 (M+H)
1-178		1,27 (6H, d, J=6,85Hz), 2,90-2,97 (1H, m), 7,09-7,11 (1H, d), 7,25-7,35 (3H, m), 7,45-7,46 (2H, m), 7,74 (1H, br s)	m/z = 277 (M+H)
1-179		1,26 (6H, d, J=6,85Hz), 2,89-2,96 (1H, m), 7,24-7,27 (4H, m), 7,51-7,53 (2H, m), 7,74 (1H, br s)	m/z = 277 (M+H)
1-180		0,93 (3H, t, J=7,34Hz), 1,31-1,40 (2H, m), 1,56-1,64 (2H, m), 2,59-2,64 (2H, m), 7,20-7,26 (4H, m), 7,50 (2H, d, J=8,31Hz), 7,74 (1H, br s)	m/z = 291 (M+H)

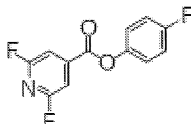
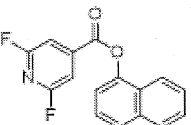
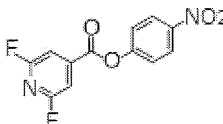
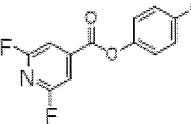
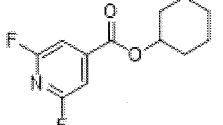
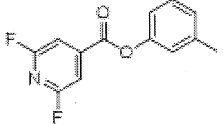
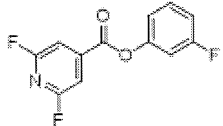
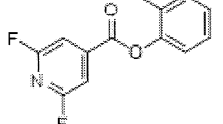
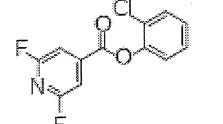
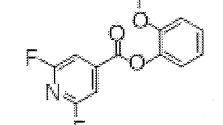
Bảng 31

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-181		0,87-0,90 (3H, m), 1,26-1,37 (6H, m), 1,56-1,64 (2H, m), 2,59-2,63 (2H, m), 7,20-7,26 (4H, m), 7,49-7,51 (2H, m), 7,73 (1H, br s)	$m/z = 319$ (M+H)
1-182		2,58 (1H, t), 4,98 (2H, d), 7,42-7,43 (2H, m)	$m/z = 197$ (M+)
1-183		5,40 (2H, s), 7,38-7,44 (7H, m)	$m/z = 249$ (M+)
1-184		1,04 (3H, t), 1,77-1,86 (2H, m), 4,33-4,36 (2H, m), 7,38-7,39 (2H, m)	$m/z = 201$ (M+)
1-185		1,42 (3H, t), 4,44 (2H, q), 7,39 (2H, t)	$m/z = 187$ (M+)
1-186		1,27 (3H, t), 2,69 (2H, q), 7,10-7,14 (2H, m), 7,26-7,29 (2H, m), 7,55 (2H, t)	$m/z = 263$ (M+)
1-187		3,83 (3H, s), 6,76-6,89 (3H, m), 7,34-7,38 (1H, m), 7,55 (2H, t)	$m/z = 265$ (M+)
1-188		4,86-4,88 (2H, m), 5,35-5,47 (2H, m), 5,97-6,07 (1H, m), 7,41 (2H, t)	$m/z = 199$ (M+)
1-189		3,99 (3H, s), 7,39 (2H, t)	$m/z = 173$ (M+)
1-190		2,51 (s, 3H), 7,08-7,14 (m, 1H), 7,26 (s, 1H), 7,32 (s, 2H), 7,59 (s, 1H), 7,74 (br. s., 1H)	$m/z = 277$ (M+H)

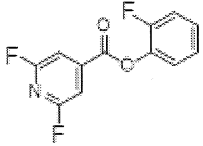
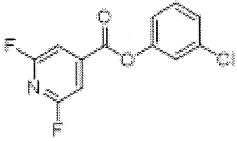
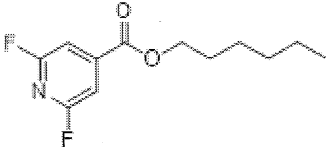
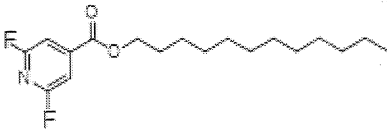
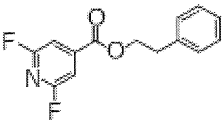
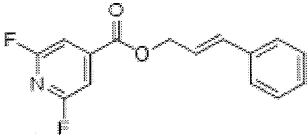
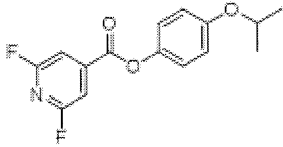
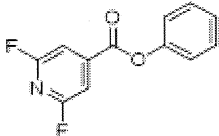
Bảng 32

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-191		7,26-7,27 (s, 1H), 7,50-7,55 (m, 2H), 7,83-7,85 (d, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,92 (s, 1H)	$m/z = 303$ (M+H)
1-192		6,59-6,60 (m, 3H), 11,47-11,49 (m, 3H), 11,79 (m, 1H), 11,95 (m, 1H), 12,33 (m, 1H)	$m/z = 281$ (M+H)
1-193		6,65-6,73 (m, 1H), 7,05-7,12 (d, 1H), 7,20 (s, 2H), 7,31 (s, 1H), 7,36 (s, 2H), 8,88 (br. S., 1H), 9,52 (br. S, 1H)	$m/z = 251$ (M+H)
1-194			$m/z = 292$ (M+H)
1-195		7,38-7,40 (t, 1H), 7,47 (s, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 8,26-8,27 (t, 1H)	$m/z = 391$ (M+H)
1-196		6,54-6,57 (m, 1H), 6,94-6,96 (m, 1H), 7,06-7,10 (t, 1H), 7,15-7,16 (t, 1H), 7,44 (s, 2H)	$m/z = 258$ (M+H)
1-197		7,50 (s, 2H), 7,65-7,67 (d, 1H), 7,93-7,96 (dd, 1H), 8,47-8,48 (d, 1H)	$m/z = 312$ (M-H)
1-198		2,39 (3H, s), 7,08-7,11 (2H, m), 7,24-7,26 (2H, m), 7,55 (2H, t)	$m/z = 250$ (M+H)
1-199		7,16-7,20 (2H, m), 7,41-7,45 (2H, m), 7,54 (2H, t)	$m/z = 270$ (M+H)
1-200		3,84 (3H, s), 6,94-6,98 (2H, m), 7,13-7,16 (2H, m), 7,54 (2H, t)	$m/z = 265$ (M+)

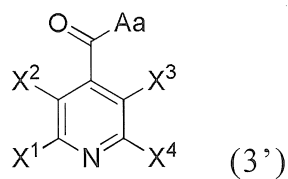
Bảng 33

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-201		7,12-7,22 (4H, m), 7,54 (2H, t)	m/z = 253 (M+)
1-202		7,38-7,40 (1H, m), 7,52-7,59 (3H, m), 7,68 (2H, m), 7,82-7,95 (3H, m)	m/z = 285 (M+)
1-203		6,88-6,93 (1H, m), 7,48-7,57 (3H, m), 8,16-8,20 (1H, m), 8,35-8,39 (1H, m)	m/z = 280 (M+)
1-204		7,38-7,41 (2H, m), 7,54-7,57 (2H, m), 7,77-7,81 (2H, m)	m/z = 260 (M+)
1-205		1,37-1,64 (6H, m), 1,78-1,81 (2H, m), 1,84-1,89 (2H, m), 5,08-5,09 (1H, m), 7,38 (2H, m)	m/z = 241 (M+)
1-206		2,41 (3H, s), 7,00-7,03 (2H, m), 7,13-7,15 (1H, m), 7,32-7,36 (1H, m), 7,55 (2H, t)	m/z = 249 (M+)
1-207		6,99-7,09 (3H, m), 7,40-7,46 (1H, m), 7,54 (2H, t)	m/z = 253 (M+)
1-208		2,23 (3H, s), 7,12-7,14 (1H, m), 7,22-7,32 (3H, m), 7,57 (2H, t)	m/z = 249 (M+)
1-209		7,28-7,74 (3H, m), 7,51-7,54 (1H, m), 7,59 (2H, t)	m/z = 269 (M+)
1-210		3,63 (3H, s), 6,99-7,05 (2H, m), 7,14-7,16 (1H, m), 7,27-7,32 (1H, m), 7,56 (2H, m)	m/z = 265 (M+)

Bảng 34

Ví dụ	Công thức	$^1\text{H-NMR}$ (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm^{-1}
1-211		7,20-7,35 (4H, m), 7,57 (2H, m)	$m/z = 253$ (M+)
1-212		7,13-7,16 (1H, m), 7,26-7,42 (3H, m), 7,54 (2H, t)	$m/z = 269$ (M+)
1-213		0,88-0,93 (3H, m), 1,26-1,47 (6H, m), 1,74-1,81 (2H, m), 4,37 (2H, t), 7,38 (2H, s)	$m/z = 243$ (M+)
1-214		0,88 (3H, t), 1,26-1,46 (18H, m), 1,74-1,81 (2H, m), 4,37 (2H, t), 7,38 (2H, m)	$m/z = 327$ (M+)
1-215		3,08 (2H, t), 4,59 (2H, t), 7,25-7,34 (5H, m), 7,36 (2H, m)	$m/z = 244$ (M-F)
1-216		5,02-5,04 (2H, m), 6,33-6,41 (1H, m), 6,77 (1H, d), 7,27-7,44 (7H, m)	$m/z = 275$ (M+)
1-217		1,29-1,36 (6H, m), 4,51-4,57 (1H, m), 6,91-6,95 (2H, m), 7,09-7,13 (2H, m), 7,54 (2H, t)	$m/z = 293$ (M+)
1-218		7,21-7,24 (2H, m), 7,31-7,36 (1H, m), 7,44-7,49 (2H, m), 7,56 (2H, m)	$m/z = 234$ (M-H)

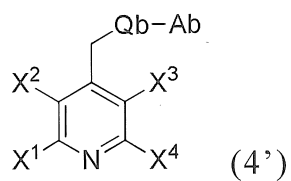
Các hợp chất của các Ví dụ từ 2-1 đến 2-5, được biểu diễn bởi công thức (3'), được thể hiện trong bảng 35,



Bảng 35

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
2-1		1,70 (6H, m), 3,26 (2H, m), 3,73 (2H, m), 6,82 (1H, m)	m/z = 245 (M+H)
2-2		4,07 (3H, s), 6,21 (1H, dd), 6,65 (1H, dd), 6,91 (1H, m), 7,04 (1H, m)	IR 1638, 1630, 1467, 1155, 1023, 803, 753
2-3		3,35 (2H, m), 3,70 (2H, m), 3,81 (4H, m), 6,86 (1H, m)	m/z = 247 (M+H)
2-4		3,22 (t, J=8,3Hz, 2H), 3,94 (t, J=8,3Hz, 2H), 6,91-6,93 (m, 1H), 7,16-7,18 (m, 1H), 7,25-7,30 (m, 2H), 8,25 (d, J=8,2Hz, 1H)	
2-5		7,84-7,95 (m, 4H), 8,05-8,07 (m, 1H)	

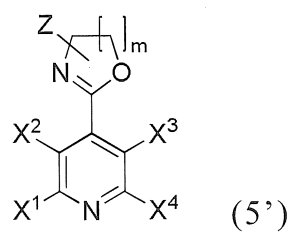
Các hợp chất của các Ví dụ 3-1 và 3-2, được biểu diễn bởi công thức (4'), được thể hiện trong bảng 36,



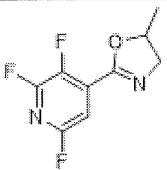
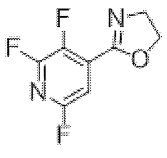
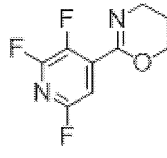
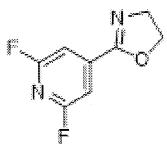
Bảng 36

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 Mhz, 500 Mhz, hoặc 600 Mhz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
3-1		2,23 (3H, s), 5,24 (2H, s), 6,85 (1H, m)	
3-2		4,89 (2H, s), 7,05 (1H, m)	IR 1641, 1480, 1455, 1430, 1364, 1268, 1206, 1154, 1088, 1023, 972, 878, 805

Các hợp chất của các Ví dụ từ 4-1 đến 4-4, được biểu diễn bởi công thức (5'), được thể hiện trong bảng 37,



Bảng 37

Ví dụ	Công thức	¹ H-NMR (được đo ở 400 MHz, 500 MHz, hoặc 600 MHz) δ ppm	ESI MS (m/z) hoặc IR (KBr) cm ⁻¹
4-1		1,29(3H, s), 3,35(1H, m), 3,74(1H, m), 4,07(1H, m), 7,42(1H, m)	m/z = 217 (M+H)
4-2		4,12 (2H, t), 4,53 (2H, t), 7,41 (1H, m)	IR 1665, 1636, 1472, 1436, 1274, 1030, 996
4-3		2,02 (2H, m), 3,65 (2H, m), 4,38 (2H, m), 7,24 (1H, m)	IR 1654, 1635, 1472, 1431, 1374, 1248, 1133, 1078, 1027, 957, 761
4-4		4,13(2H, t), 4,50(2H, t), 7,33(2H, s)	m/z = 185 (M+H)

Ví dụ 9

Hoạt tính chống bệnh đạo ôn

Dung dịch axeton của từng hợp chất trong mỗi ví dụ được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 0,1 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10-lần với nước để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Thực hiện quá trình thấm vào trong đất với 0,25 mL dung dịch được pha loãng trên 1 mL đất. Thóc giống (giống: Jikkoku) được cho ép nảy mầm được gieo vào đất trồng trong các buồng trồng cây. Huyền phù chứa bào tử đỉnh của *Pyricularia oryzae* được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là $1,5 \times 10^5$ bào tử đỉnh/mL đến 5×10^5 bào tử đỉnh/mL được cấy lúa được trồng đến giai đoạn lá thứ hai bằng cách thực hiện việc phun, và sau đó để yên trong vòng 24 giờ ở trong buồng ẩm (mà trong đó nhiệt độ là 25°C và độ ẩm là 100%). Sau đó, lúa được tiếp tục trồng trong các buồng trồng thực vật, và số lượng thương tổn ở lá thứ hai được đếm. Trị số kiểm soát được tính dựa trên số

lượng thương tổn đếm được theo công thức toán học dưới đây.

Trị số kiểm soát = ((số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị – số lượng thương tổn ở các thực vật được điều trị) / số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Các trị số kiểm soát của các hợp chất của các ví dụ dưới đây là 80 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát đối với bệnh đạo ôn được xác nhận.

1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-9, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-32, 1-33, 1-35, 1-36, 1-37, 1-39, 1-40, 1-44, 1-46, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-52, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-59, 1-61, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-70, 1-71, 1-73, 1-74, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-91, 1-92, 1-93, 1-96, 1-98, 1-99, 1-100, 1-102, 1-103, 1-104, 1-105, 1-107, 1-108, 1-109, 1-110, 1-111, 1-112, 1-114, 1-115, 1-117, 1-118, 1-119, 1-120, 1-122, 1-123, 1-124, 1-125, 1-127, 1-130, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-137, 1-138, 1-139, 1-140, 1-141, 1-143, 1-145, 1-146, 1-147, 1-151, 1-152, 1-153, 1-155, 1-159, 1-168, 1-169, 1-170, 1-173, 1-174, 1-175, 1-176, 1-178, 1-179, 1-180, 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-190, 1-191, 1-192, 1-193, 1-194, 1-196, 1-197, 1-198, 1-199, 1-200, 1-201, 1-202, 1-203, 1-204, 1-205, 1-206, 1-207, 1-208, 1-209, 1-210, 1-211, 1-213, 1-214, 1-218, 2-2, 2-4, 2-5, 3-1, 4-2, 4-3, 4-4

Ví dụ 10

Hoạt tính chống bệnh đạo ôn

Dung dịch axeton của từng hợp chất trong mỗi ví dụ được điều chế ở nồng độ thích hợp, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước, tiếp theo bổ sung 1/1000 lần theo thể tích NEOESTERIN vào dung dịch được pha

loãng để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Từng hợp chất được phun lên trên lúa được trồng trong các chậu đến giai đoạn lá thứ hai hoặc giai đoạn lá thứ ba, và sau đó, một ngày sau khi thực hiện việc phun, huyền phù chứa bào tử dính của *Pyricularia oryzae* được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là $1,5 \times 10^5$ bào tử dính/mL đến 5×10^5 bào tử dính/mL được cấy bằng cách thực hiện việc phun, tiếp theo để lúa yên trong vòng 24 giờ ở rong buồng ẩm (mà trong đó nhiệt độ là 25°C và độ ẩm là 100%). Sau đó, lúa được trồng trong các buồng trồng thực vật, và số lượng thương tổn ở lá thứ hai được đếm. Trị số kiểm soát được tính dựa trên số lượng thương tổn đếm được theo công thức toán học dưới đây.

Trị số kiểm soát = ((số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị – số lượng thương tổn ở các thực vật được điều trị) / số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị) $\times 100$

Các trị số kiểm soát của các hợp chất của các ví dụ dưới đây là 80 hoặc lớn hơn ở nồng độ là 25 ppm, và các hiệu quả kiểm soát chống lại bệnh đạo ôn được xác nhận.

1-19, 1-30, 1-38, 1-41, 1-44, 1-59, 1-134, 1-135, 1-139, 1-168, 1-172, 1-174

Các trị số kiểm soát của các hợp chất của các ví dụ dưới đây là 80 hoặc lớn hơn ở nồng độ là 200 ppm, và các hiệu quả kiểm soát chống lại bệnh đạo ôn được xác nhận.

1-3, 1-18, 1-32, 1-33, 1-86, 1-93, 1-98, 1-102, 1-103, 1-105, 1-129, 1-131, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-137, 1-138, 1-139, 1-168, 1-169, 1-170, 1-172, 1-173, 1-174, 1-175, 1-176, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180, 1-183, 1-187, 1-190, 1-191, 1-193, 1-200, 1-202, 1-204, 1-210, 4-4

Ví dụ 11

Hoạt tính chống lại vi khuẩn gây bệnh cháy lá lúa

Dung dịch axeton của từng hợp chất trong mỗi ví dụ được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 2 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước, tiếp theo bổ sung 1/1000 lần theo thể tích NEOESTERIN vào dung dịch được pha loãng để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Từng hợp chất được phun lên trên lúa được trồng trong các chậu đến giai đoạn đâm chồi, và sau đó, ba ngày sau khi thực hiện việc phun, *Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae* được cấy bằng cách để lại vết xước bằng nhíp kim. Lúa được để yên qua đêm trong buồng ẩm (mà trong đó nhiệt độ là 21°C và độ ẩm là 100%), và sau đó được trồng trong nhà kính để đo chiều dài của các tổn thương (chiều dài tổn thương), 11 ngày sau khi cấy. Trị số kiểm soát được tính dựa trên trung bình chiều dài tổn thương đo được theo công thức toán học dưới đây.

Trị số kiểm soát = ((chiều dài tổn thương ở thực vật không được điều trị – chiều dài tổn thương ở thực vật được điều trị) / chiều dài tổn thương ở thực vật không được điều trị) × 100

Các trị số kiểm soát của các hợp chất dưới đây là 50 hoặc lớn hơn ở nồng độ là 200 ppm, và các hiệu quả kiểm soát chống vi khuẩn gây bệnh cháy lá lúa được xác nhận.

1-134, 1-135, 1-136, 1-161

Ví dụ 12

Hoạt tính chống bệnh phấn trắng ở lúa mạch

Dung dịch axeton của từng hợp chất trong mỗi ví dụ được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 2 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước, tiếp theo bổ sung 1/1000 lần theo thể tích của NEOESTERIN vào dung dịch được pha loãng để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Từng

hợp chất được phun lên trên hai hàng lúa mạch được trồng trong các chậu nhỏ (30 cm × 20 cm) trong gần một tháng sau khi gieo hạt, và sau đó, 7 ngày sau khi thực hiện việc phun, hai hàng lúa mạch được để trong nhà kính dưới các điều kiện mà trong đó cho phép nhiễm *Erysiphe graminis* tự nhiên, tiếp theo trồng hai hàng lúa mạch trong gần 1 tháng dưới các điều kiện mà trong đó cho phép nhiễm bệnh liên tục. Số lượng các tổn thương ở lá đồng trên thân chính được đếm, và trị số kiểm soát được tính dựa trên số lượng các tổn thương đã đếm được theo công thức toán học dưới đây.

Trị số kiểm soát = ((số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị – số lượng thương tổn ở các thực vật được điều trị) / số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị) × 100

Các trị số kiểm soát của các hợp chất dưới đây là 50 hoặc lớn hơn ở nồng độ là 200 ppm, và các hiệu quả kiểm soát chống lại bệnh phấn trắng ở lúa mạch được xác nhận.

1-41, 1-134, 1-135

Ví dụ 13

Hoạt tính chống lại bệnh phấn trắng ở lúa mì

Bột thấm ướt được của ví dụ các hợp chất 1-134 và 1-135 được điều chế theo Ví dụ điều chế 1 dưới đây, một cách tương ứng, tiếp theo pha bột thấm ướt được đến 1000 lần với nước để điều chế các chất lỏng phun. Các chất lỏng phun được điều chế được phun lên trên lúa mì hai lần ở giai đoạn trổ bông và 10 ngày trước giai đoạn trổ bông với thể tích chất lỏng là 1 L/m², một cách tương ứng. Các tổn thương trên lá đồng được kiểm tra theo các chỉ số dưới đây xấp xỉ 4 tuần sau khi áp dụng phun lần thứ hai. Mức độ nghiêm trọng được tính dựa trên các chỉ số, và trị số kiểm soát được tính từ mức độ nghiêm trọng theo công thức toán học dưới đây.

Các chỉ số (0 đến 5)

0: Không có tổn thương được quan sát thấy.

1: 1 đến 3 tổn thương được quan sát thấy.

2: 4 đến 10 tổn thương được quan sát thấy.

3: 11 đến 20 tổn thương được quan sát thấy.

4: 21 tổn thương hoặc nhiều hơn được quan sát thấy, và diện tích các tổn thương nhỏ hơn một nửa bề mặt lá.

5: 21 tổn thương hoặc nhiều hơn được quan sát thấy, và diện tích các tổn thương bằng một nửa bề mặt lá hoặc nhiều hơn.

Trị số kiểm soát = ((mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị – mức độ nghiêm trọng ở các thực vật được điều trị) / mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Các trị số kiểm soát của ví dụ các hợp chất 1-134 và 1-135 là 50 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát được xác nhận.

Ví dụ 14

Hoạt tính chống bệnh nấm màu gỉ sắt trên lúa mỳ

Các bột thấm ướt được của ví dụ hợp chất 1-135 được điều chế theo Ví dụ điều chế 1 dưới đây, sau đó pha loãng bột thấm ướt được đến 1000 lần với nước để điều chế các chất lỏng phun. Tiến hành phun chất lỏng phun được điều chế lên trên lúa mỳ hai lần ở giai đoạn trổ bông và 10 ngày trước giai đoạn trổ bông với thể tích chất lỏng là 1 L/m². Các tổn thương trên lá đồng được kiểm tra theo các chỉ số dưới đây xấp xỉ 4 tuần sau khi áp dụng việc phun lần thứ hai. Mức độ nghiêm trọng được tính dựa trên các chỉ số, và trị số kiểm soát được tính từ mức độ nghiêm trọng thu được theo công thức toán học dưới đây.

Các chỉ số (0 đến 5)

0: Không có tổn thương được quan sát thấy.

1: 1 đến 3 tổn thương được quan sát thấy.

2: 4 đến 10 tổn thương được quan sát thấy.

3: 11 đến 20 tổn thương được quan sát thấy.

4: 21 tổn thương hoặc nhiều hơn được quan sát thấy, và diện tích các tổn thương nhỏ hơn một nửa bề mặt lá.

5: 21 tổn thương hoặc nhiều hơn được xác nhận, và diện tích các tổn thương là một nửa bề mặt lá hoặc nhiều hơn.

Trị số kiểm soát = ((mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị – mức độ nghiêm trọng ở các thực vật được điều trị) / mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Trị số kiểm soát của ví dụ hợp chất 1-135 là 50 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát chống lại bệnh nấm màu gỉ sắt trên lúa mì được xác nhận.

Ví dụ 15

Hoạt tính chống bệnh mốc sương trên dưa chuột

Dung dịch axeton của mỗi ví dụ hợp chất được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 0,4 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. 5 mL dung dịch đã được pha loãng được làm thấm vào đất trên mỗi chậu ở rễ dưa chuột (giống : Suyo) ở giai đoạn lá đầu tiên được trồng trong chậu. 7 ngày sau khi điều trị, huyền phù chứa bào tử của *Pseudoperonospora cubensis* được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 5×10^4 bào tử/mL được cấy vào dưa chuột bằng cách thực hiện việc phun, sau đó để yên dưa chuột trong vòng 24 giờ ở trong

buồng ẩm (mà trong đó nhiệt độ là 25°C và độ ẩm là 100%). Sau đó, dưa chuột được trồng trong nhà kính, và, 7 ngày sau khi cấy, các tổn thương ở lá thứ hai được kiểm tra theo các chỉ số dưới đây. Mức độ nghiêm trọng được tính dựa trên các chỉ số, và trị số kiểm soát được tính từ mức độ nghiêm trọng thu được theo công thức toán học dưới đây.

Các chỉ số (0 đến 5)

0: Không có tổn thương được quan sát thấy.

1: Diện tích của các tổn thương nhỏ hơn 5% bề mặt lá.

2: Diện tích của các tổn thương là 5% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 25% bề mặt lá.

3: Diện tích của các tổn thương là 25% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 50% bề mặt lá.

4: Diện tích của các tổn thương là 50% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 80% bề mặt lá.

5: Diện tích của các tổn thương là 80% hoặc lớn hơn bề mặt lá.

Trị số kiểm soát = ((mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị – mức độ nghiêm trọng ở các thực vật được điều trị) / mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Các trị số kiểm soát của các hợp chất dưới đây là 70 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát đối với bệnh nấm sương dưa chuột được xác nhận.

1-117, 1-134, 1-135, 1-143, 1-218, 4-2

Ví dụ 16

Hoạt tính chống bệnh mốc sương trên dưa chuột

Dung dịch axeton của từng ví dụ hợp chất được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 1 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Phun lên trên dưa chuột (giống : Suyo) ở giai đoạn lá đầu tiên được trồng trong các chậu với lượng 1 mL dung dịch đã được pha loãng trên mỗi chậu. 7 ngày sau khi phun, huyền phù chứa bào tử của *Pseudoperonospora cubensis* được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 5×10^4 bào tử/mL được cấy vào dưa chuột bằng cách thực hiện việc phun, tiếp theo để yên dưa chuột trong vòng 24 giờ ở trong buồng ẩm (mà trong đó nhiệt độ là 25°C và độ ẩm là 100%). Sau đó, dưa chuột được trồng trong nhà kính, và, 7 ngày sau khi cấy, tỷ lệ diện tích của các tổn thương ở lá thứ hai được xác định theo các chỉ số dưới đây. Mức độ nghiêm trọng được tính dựa trên các chỉ số, và trị số kiểm soát được tính từ mức độ nghiêm trọng thu được theo công thức toán học dưới đây.

Các chỉ số (0 đến 5)

0: Không có tổn thương được quan sát thấy.

1: Diện tích của các tổn thương nhỏ hơn 5% bề mặt lá.

2: Diện tích của các tổn thương là 5% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 25% bề mặt lá.

3: Diện tích của các tổn thương là 25% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 50% bề mặt lá.

4: Diện tích của các tổn thương là 50% hoặc lớn hơn nhưng nhỏ hơn 80% bề mặt lá.

5: Diện tích của các tổn thương là 80% hoặc lớn hơn bề mặt lá.

Trị số kiểm soát = ((mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị – mức độ nghiêm trọng ở các thực vật được điều trị) / mức độ nghiêm trọng ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Các trị số kiểm soát của các hợp chất dưới đây là 70 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát chống bệnh mốc sương ở dưa chuột được xác nhận.

1-143, 1-218

Ví dụ 17

Hoạt tính chống bệnh đốm vi khuẩn ở dưa chuột

Các bột thấm ướt được của ví dụ hợp chất 1-134 được điều chế theo Ví dụ điều chế 1 dưới đây, Bột thấm ướt được được pha loãng đến 6666 lần với nước, và sau đó 20 mL dung dịch được pha loãng trên mỗi chậu được áp dụng cho dưa chuột (giống: Natsusuzumi) ở giai đoạn lá thứ ba được trồng trong chậu bằng cách làm cho dung dịch được pha loãng được thấm vào đất, và sau đó dưa chuột được mang đi trồng. 28 ngày sau khi trồng, số lượng thương tổn được tạo ra ở lá thứ 11 đến lá thứ 20 được đếm. Trị số kiểm soát được tính từ số lượng các tổn thương đã thu được theo công thức toán học dưới đây.

Trị số kiểm soát = ((số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị – số lượng thương tổn ở các thực vật được điều trị) / số lượng thương tổn ở các thực vật không được điều trị) $\times$ 100

Trị số kiểm soát của hợp chất ví dụ 1-134 là 60 hoặc lớn hơn, và các hiệu quả kiểm soát của nó được xác nhận.

Ví dụ 18

Sự ngăn cản sinh trưởng của lúa

Các dung dịch axeton của mỗi hợp chất ví dụ và các hợp chất được mô tả trong các tài liệu kỹ thuật đã có được thể hiện trong bảng 38 dưới đây (sau đây, được gọi là các hợp chất của các Ví dụ so sánh từ 1 đến 5, một

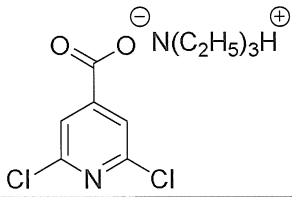
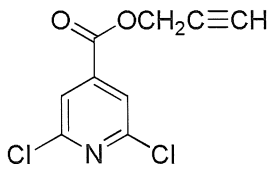
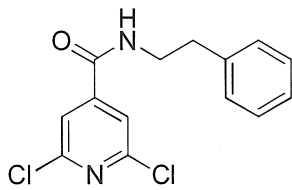
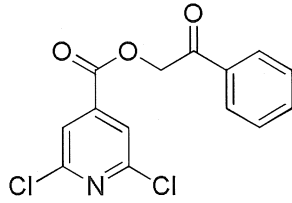
cách tương ứng) được điều chế sao cho hàm lượng của chúng là 0,2 mg/mL, và sau đó được pha loãng đến 10 lần với nước để được đưa vào thực hiện thử nghiệm. Thực hiện thấm vào đất 0,25 mL dung dịch được pha loãng trên 1 mL đất. Sau đó, thóc giống (giống: Jikkoku) được cho ép nảy mầm được gieo vào đất trồng trong các buồng trồng cây. Chiều dài cây của lúa được phát triển đến giai đoạn lá thứ nhất được đo, và tỷ lệ của chiều dài cây, tương ứng với chiều dài cây không được điều trị được đặt là 100, (sau đây, được gọi là “tỷ lệ chiều dài cây tương ứng với chiều dài cây không được điều trị”) được tính. Việc có hoặc không có sự ngăn cản sinh trưởng được xác định từ tỷ lệ đã tính.

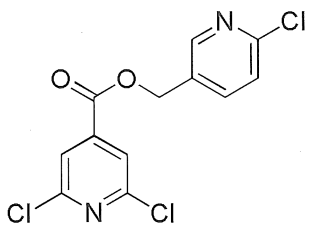
Các tỷ lệ chiều dài cây tương ứng với chiều dài cây không được điều trị của ví dụ các hợp chất dưới đây là 80 hoặc lớn hơn, và có thể xác nhận là độc tính tế bào bị gây ra bởi các hợp chất theo sáng chế được giảm xuống so với các hợp chất của các ví dụ so sánh từ 1 đến 5, Các kết quả đã cho thấy là tổn hại bị gây ra bởi ví dụ các hợp chất dưới đây được giảm xuống so với các hợp chất có công thức (1) mà trong đó X^1 , X^2 , X^3 hoặc X^4 chứa nguyên tử clo.

1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-97, 1-98, 1-99, 1-100, 1-101, 1-102, 1-103, 1-104, 1-105, 1-106, 1-107, 1-108, 1-109, 1-110, 1-111, 1-112, 1-113, 1-116, 1-117, 1-118, 1-120, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-125, 1-126, 1-127, 1-128,

1-130, 1-131, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-136, 1-137, 1-138, 1-139,
 1-141, 1-142, 1-143, 1-148, 1-149, 1-150, 1-151, 1-152, 1-155, 1-156,
 1-158, 1-160, 1-161, 1-164, 1-165, 1-166, 1-167, 1-168, 1-169, 1-170,
 1-171, 1-172, 1-173, 1-174, 1-175, 1-176, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180,
 1-181, 1-182, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-190,
 1-191, 1-192, 1-193, 1-194, 1-195, 1-196, 1-197, 1-198, 1-199, 1-200,
 1-201, 1-202, 1-203, 1-204, 1-205, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 3-1, 3-2, 4-1,
 4-2, 4-3, 4-4, 4-5

Bảng 38

	Tài liệu sáng chế	Hợp chất số	Công thức	Tỷ lệ chiều dài cây trồng ứng với chiều dài cây không được điều trị
Ví dụ so sánh 1	Đơn sáng chế Nhật Bản chưa được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Sho 63-93766	4,2		49
Ví dụ so sánh 2	Đơn sáng chế Nhật Bản chưa được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Sho 63-93766	1,29		52
Ví dụ so sánh 3	Đơn sáng chế Nhật Bản chưa được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 9-165374	1		45
Ví dụ so sánh 4	Đơn sáng chế Nhật Bản chưa được xét nghiệm, Công bố lần đầu số Hei 10-95772	1		64

Ví dụ so sánh 5	Đơn sáng chế quốc tế Sáng chế, Công bố Số 2005-68430	I-1		66
-----------------------	--	-----	--	----

Ví dụ điều chế 1

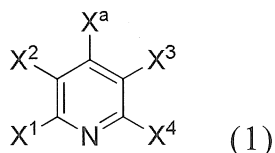
10 phần theo khối lượng của mỗi ví dụ hợp chất, 2 phần theo khối lượng là lauryl sulfat, 2 phần theo khối lượng là polyoxyetylen alkyl ete, 3 phần theo khối lượng là lignin sulfonat, 4 phần theo khối lượng là cacbon trắng, và 79 phần theo khối lượng là đất sét được trộn lẫn và được tán thành bột để thu được bột thấm ướt được.

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Theo sáng chế, chất kiểm soát bệnh ở thực vật và hợp chất mới mà có thể làm giảm tổn hại đến thực vật, và phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật được đề xuất. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật và hợp chất mới theo sáng chế có hoạt tính gây cảm ứng kháng bệnh ưu việt và có ích trong việc kiểm soát các bệnh ở thực vật.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật bao gồm hợp chất có công thức (1) làm thành phần hoạt tính,

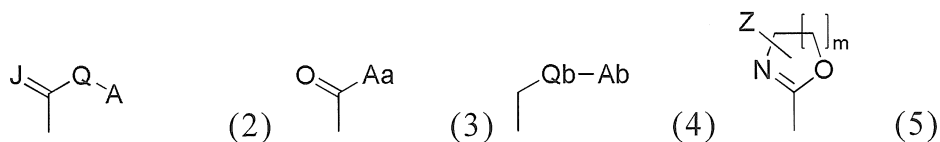


trong công thức (1),

X^1 và X^4 là nguyên tử flo

X^2 và X^3 là giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, hoặc nguyên tử flo, trong đó X^2 hoặc X^3 là nguyên tử hydro, hoặc X^2 và X^3 là các nguyên tử hydro

X^a là nhóm có công thức (2), (3), (4) hoặc (5),



trong công thức (2), J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

A là:

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm

được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm phenylcarbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy;

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc nhóm D;

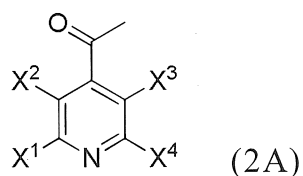
nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl,

nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl,

nhóm naphtyl,

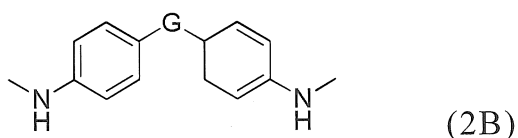
nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E), hoặc

nhóm công thức (2A) [trong công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là giống như được xác định trong công thức (1)],



trong đó, khi A là nhóm có công thức (2A), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai:

-NH-CH₂-CH=CH-CH₂-O-, nhóm công thức hóa trị hai:
 -NH-CH₂-CH=CH-CH₂-NH-, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm
 xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai:
 -NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-, nhóm 1,3-phenylendiamino, nhóm
 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị
 hai: -NH-(1,4-phenylen)-O-, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B) [trong
 công thức (2B), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công
 thức hóa trị hai: -SO₂-] (mà trong đó n là số nguyên từ 2 đến 8), và



khi A không là nhóm có công thức (2A), Q là nguyên tử oxy, nguyên
 tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: -NH-, hoặc nhóm công thức hóa
 trị hai: -N(CH₃)-,

trong công thức (3), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm
 1-metyl-1-1H-pyrol-2-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm indolin-1-yl, nhóm
 benzoisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxit-2-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm
 azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrolidin-1-yl, nhóm
 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm
 1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm
 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm
 isoindolin-2-yl,

trong công thức (4), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh,
 nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai:
 -N(CH₃)-,

Ab là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nguyên tử hydro, nhóm metoxycarbonyl, và nhóm N-tert-butoxycarbonylamino;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E),

trong công thức (5), m là số nguyên từ 1 đến 3, Z là nguyên tử hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm methyl,

nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm 5-methyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, nhóm phenylcarbonyl, các nhóm pyridyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm methylthio, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkylcarbonyl C1-4, nhóm metoxycarbonyl, nhóm etoxycarbonyl, nhóm benzylaminocarbonyl, nhóm axetoxy, nhóm nitro, và nhóm xyano, và

nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl,

nhóm pyridazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm 2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl, nhóm dihydrothiazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, nhóm isothiazolyl, và nhóm triazolyl.

2. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo điểm 1, trong đó J trong công thức (2) là nguyên tử oxy.
3. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo điểm 1 hoặc 2, trong đó Q trong công thức (2) là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.
4. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo điểm 1 hoặc 2, trong đó Q trong công thức (2) là nguyên tử oxy.
5. Chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó A trong công thức (2) là:

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

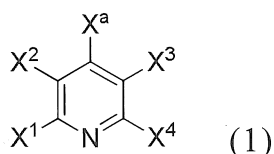
nhóm phenylcacbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy;

nhóm phenylsulfony mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy và nhóm benzyl; hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E).

2 6. Hợp chất của công thức (1) (ngoại trừ hợp chất có công thức (2) trong đó J và Q là các nguyên tử oxy, A là nhóm methyl, nhóm ethyl hoặc nhóm xyclohexyl, hoặc hợp chất có công thức (2) trong đó J là nguyên tử oxy, Q là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-, và A là nhóm 3-clo-4-flophenyl),

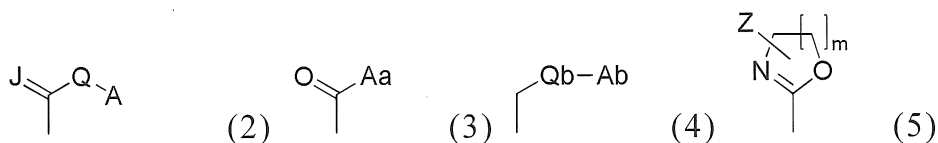


trong công thức (1),

X^1 và X^4 là các nguyên tử flo

X^2 và X^3 là giống nhau hoặc khác nhau, và là nguyên tử hydro, hoặc nguyên tử flo, trong đó X^2 hoặc X^3 là nguyên tử hydro, hoặc X^2 và X^3 là các nguyên tử hydro.

X^a là nhóm có công thức (2), (3), (4) hoặc (5),



trong công thức (2), J là nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh,

A là:

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylsulfonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm phenylcacbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy,

nhóm phenylsulfonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy, và nhóm benzyl,

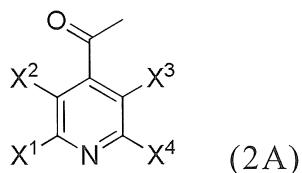
nhóm 5, 6, 7, 8-tetrahydronaphtyl,

nhóm naphtyl,

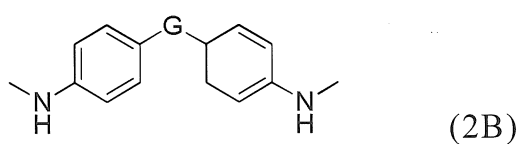
nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E), hoặc

nhóm công thức (2A) [trong công thức (2A), X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là

giống như được xác định trong công thức (1)],



trong đó, khi A là nhóm có công thức (2A), Q là nhóm có công thức hóa trị hai: $-O-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(CH_2)_n-NH-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-O-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-O-$, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-CH_2-CH=CH-CH_2-NH-$, nhóm xyclohexan-1,4-diylldioxy, nhóm xyclohexan-1,4-diylldiamino, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(xyclohexan-1,4-diyl)-O-$, nhóm 1,3-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendiamino, nhóm 1,4-phenylendioxy, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-(1,4-phenylen)-O-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai (2B) [trong công thức (2B), G là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-SO_2-$] (mà trong đó n là số nguyên từ 2 đến 8), và



khi A không là nhóm có công thức (2A), Q là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, nhóm công thức hóa trị hai: $-NH-$, hoặc nhóm công thức hóa trị hai: $-N(CH_3)-$,

trong công thức (3), Aa là nhóm piperidin-1-yl, nhóm morpholin-4-yl, nhóm piperazin-1-yl, nhóm azetidin-1-yl, nhóm 2,5-dioxopyrrolidin-1-yl, nhóm 3-oxoisothiazol-2(3H)-yl, nhóm benzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm

1,1-dioxo-3-oxobenzo[d]isothiazol-2(3H)-yl, nhóm
 5,6-dihydro-4H-1,3-oxazin-2-yl, nhóm 1H-pyrol-2-yl hoặc nhóm
 isoindolin-2-yl,

trong công thức (4), Qb là nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh,
 nhóm công thức hóa trị hai: -NH- hoặc nhóm công thức hóa trị hai:
 -N(CH₃)-,

Ab là:

nhóm alkyl C1-10 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được
 chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm C, nhóm metoxycarbonyl, và
 nhóm N-tert-butoxycarbonylamino;

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được
 chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được
 chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C,

nhóm alkylcarbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba
 nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm C, hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được
 chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ
 Nhóm E),

trong công thức (5), m là số nguyên từ 1 đến 3, Z là nguyên tử
 hydro, nguyên tử halogen hoặc nhóm methyl,

nhóm C gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm
 amino, nhóm 5-methyl-1,3-dioxol-2-on-4-yl, nhóm phenylcarbonyl, các
 nhóm pyridyl mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ các
 nhóm thuộc Nhóm D, và các nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một

đến bốn nhóm được chọn từ các nhóm thuộc Nhóm D,

nhóm D gồm có các nguyên tử halogen, nhóm hydroxyl, nhóm amino, nhóm metylthio, các nhóm alkyl C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nguyên tử halogen, các nhóm alkylcacbonyl C1-4, nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm benzylaminocacbonyl, nhóm axetoxy, nhóm nitro, và nhóm xyano, và

nhóm E gồm có nhóm pyridyl, nhóm thiazolyl, nhóm pyrazinyl, nhóm isothiazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm benzimidazolyl, nhóm thienyl, nhóm furanyl, nhóm benzoxanyl, nhóm 2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl, nhóm dihydrothiazolyl, nhóm benzothiazolyl, nhóm benzoisothiazolyl, nhóm benzisothiazol-3(2H)-on-1,1-dioxidyl, nhóm dibenzofuranyl, nhóm isothiazolyl, và nhóm triazolyl.],

7. Hợp chất theo điểm 6, trong đó J trong công thức (2) là nguyên tử oxy.
8. Hợp chất theo điểm 6 hoặc 7, trong đó Q trong công thức (2) là nhóm có công thức hóa trị hai: -NH-.
9. Hợp chất theo điểm 6 hoặc 7, trong đó Q trong công thức (2) là nguyên tử oxy.
10. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 6 đến 9, trong đó A trong công thức (2) là:

nhóm alkenyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkynyl C2-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkylcacbonyl C1-8 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm alkyloxy C1-4 mà có thể được thế với từ một đến ba nhóm được chọn từ Nhóm C,

nhóm phenylcacbonyl mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm benzyl, nhóm phenyl, và nhóm phenoxy;

nhóm phenylsulfony mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ nhóm D;

nhóm phenyl mà có thể được thế với từ một đến năm nhóm được chọn từ nhóm bao gồm các nhóm thuộc Nhóm D, nhóm phenoxy và nhóm benzyl; hoặc

nhóm dị vòng mà có thể được thế với từ một đến bốn nhóm được chọn từ Nhóm D (nhóm dị vòng là nhóm được chọn từ Nhóm E).

11. Phương pháp kiểm soát bệnh ở thực vật, phương pháp này bao gồm bước: cho chất kiểm soát bệnh ở thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 hoặc hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 6 đến 10 tiếp xúc với thân thực vật hoặc hạt giống, hoặc phối chế chất kiểm soát bệnh ở thực vật hoặc hợp chất vào trong nền canh tác.