



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

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

(11)



1-0041925

(51)^{2020.01} C07D 333/38; A01P 1/00; A01N 43/10; (13) B
A01N 43/28

(21) 1-2021-00330

(22) 03/07/2019

(86) PCT/EP2019/067827 03/07/2019

(87) WO 2020/007904 09/01/2020

(30) 18181930.1 05/07/2018 EP

(45) 25/12/2024 441

(43) 26/04/2021 397

(73) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

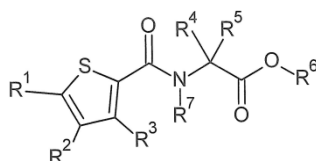
Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany

(72) BERNIER, David (FR); BRUNET, Stéphane (FR); COQUERON, Pierre-Yves (FR);
DUFOUR, Jérémy (FR); KNOBLOCH, Thomas (FR); NICOLAS, Lionel (FR);
TSUCHIYA, Tomoki (JP).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT THIOPHENCARBOXAMIT ĐƯỢC THỂ VÀ CÁC CHẤT TƯƠNG
TỰ CỦA NÓ, CHẾ PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY, QUY TRÌNH ĐIỀU CHẾ
HỢP CHẤT NÀY, VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ CÁC BỆNH DO VI
KHUẨN

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất thiophen carboxamit được thể và các chất tương tự của chúng có công thức (II) có thể được sử dụng để bảo vệ thực vật khỏi các bệnh do vi khuẩn, cụ thể là các bệnh do vi khuẩn gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas*. Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm chứa hợp chất này và các quy trình điều chế các hợp chất này, và phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn.



II

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến thiophen carboxamit được thể và các chất tương tự của chúng mà có thể được sử dụng để bảo vệ thực vật khỏi các bệnh do vi khuẩn, cụ thể là gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas*.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Vi khuẩn gây bệnh cho thực vật có thể gây ra các bệnh gây thiệt hại kinh tế nghiêm trọng trên khắp thế giới. Vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas* là một trong các vi khuẩn gây bệnh cho thực vật được coi là tàn phá nhất. Chúng là tác nhân gây ra các bệnh khác nhau trên các thực vật chủ khác nhau có ý nghĩa nông học. Các ví dụ về các bệnh này bao gồm bệnh đốm lá do vi khuẩn (gây ra bởi *Xanthomonas campestris* pv. *vesicatoria*) ảnh hưởng đến hồ tiêu và cà chua, bệnh thối đen các cây họ thập tự, (gây ra bởi *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*) ảnh hưởng đến tất cả các cây trồng thuộc chi cải (ví dụ cải Brussels, bắp cải, súp lơ và bông cải xanh), bệnh loét trên cây có múi (gây ra bởi *Xanthomonas axonopodis* pv. *citri*) ảnh hưởng đến cây có múi (chanh, cam, bưởi chùm, bưởi), bệnh cháy lá do vi khuẩn (gây ra bởi *Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*) ảnh hưởng đến lúa, bệnh đốm lá (gây ra bởi *Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*) ảnh hưởng đến loài *Prunus* (ví dụ, mơ, mận, đào), bệnh bạc lá do vi khuẩn thông thường (gây ra bởi *Xanthomonas phaseoli*) ảnh hưởng đến đậu, bệnh vi khuẩn gây tàn lụi sắn (gây ra bởi *Xanthomonas axonopodis* pv. *manihotis*) ảnh hưởng đến sắn và bệnh đốm lá góc cạnh/bệnh bạc lá do vi khuẩn (gây ra bởi *Xanthomonas campestris* pv. *malvacearum*) ảnh hưởng đến bông.

Các bệnh ở thực vật do vi khuẩn có thể được phòng trừ theo nhiều cách khác nhau, bao gồm chủ yếu là sử dụng các giống cây trồng kháng bệnh và sử dụng thuốc diệt vi khuẩn (tự nhiên hoặc tổng hợp). Cuộc khủng hoảng kháng thuốc kháng sinh trong y học và sự xuất hiện của một số mầm bệnh thực vật kháng thuốc kháng sinh đã kích khởi sự phát triển của các giải pháp thay thế thuốc kháng sinh nhằm duy trì hiệu quả của chúng và mở rộng phạm vi của các giải pháp quản lý dịch bệnh. Do đó, các sản phẩm không tác động trực tiếp lên vi khuẩn gây bệnh, tức là không có tác dụng kháng sinh trực tiếp, nhưng kích thích hệ thống phòng thủ của chính cây trồng đã được phát triển. Những sản phẩm này được gọi là chất hoạt hóa phòng vệ

thực vật. Các ví dụ về các chất hoạt hóa phòng vệ thực vật bao gồm Acibenzolar-S-methyl (được bán trên thị trường với tên Bion® và Actigard®), axit 2,6-dicloisonicotinic, axit β -aminobutyric, probenazol (Oryzemat®), axit salixylic, riboflavin, prohexadion-canxi, kali phosphonat, protein harpin (Messenger®) và methyl jasmonat.

Mặc dù nhiều hợp chất hữu cơ và vô cơ khác nhau đã được chứng minh là có tác dụng hoạt hóa tính kháng ở thực vật, nhưng hiện chỉ có vài sản phẩm được bán trên thị trường.

Do đó, vẫn có nhu cầu cung cấp các hóa chất và phương pháp mới cho phép phòng trừ hiệu quả các bệnh do vi khuẩn, đặc biệt là các bệnh do vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas*, ở liều lượng thấp đồng thời không tương tác trực tiếp với vi khuẩn để ngăn cản sự phát triển của tính kháng. Vì các hóa chất này không tương tác trực tiếp với vi khuẩn, nên không có khả năng chúng phát triển khả năng kháng các hóa chất này.

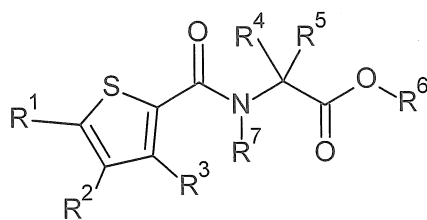
Các tác giả sáng chế đã chứng minh được rằng các chất hóa học mới thuộc nhóm dẫn xuất thiophencarboxamit được thể đưa ra được giải pháp cho những vấn đề nêu trên.

Một số dẫn xuất thiophencarboxamit được thể đã biết là hữu dụng để chống lại các bệnh ở thực vật. Chẳng hạn, US 5,534,541 mô tả các dẫn xuất halogeno của axit thiophen carboxylic hữu dụng để bảo vệ thực vật khỏi sự tấn công của các vi sinh vật hại thực vật, như nấm và vi khuẩn, thông qua tác động trực tiếp hoặc tác động ngấm vào qua rễ. Tuy nhiên, các hợp chất này được phát hiện bởi các tác giả sáng chế là có hiệu lực thấp đối với *Xanthomonas campestris pv. campestris* ở liều thấp.

Ví dụ khác về các dẫn xuất halogeno của axit thiophen carboxylic được mô tả trong WO2004/024692. Các dẫn xuất này được cho là hữu hiệu trong việc phòng trừ các bệnh do nấm. Chúng đạt được tác dụng của chúng thông qua ảnh hưởng trực tiếp lên các vi sinh vật không mong muốn nhưng cũng nhờ cả tác dụng cảm ứng tính kháng trên thực vật. WO2004/024692 cũng đề xuất rằng các hợp chất này có thể hữu dụng trong việc phòng trừ các bệnh do vi khuẩn nhưng không đưa ra được bằng chứng về hoạt tính như vậy.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (II)



(II)

trong đó

R^1 , R^2 và R^3 là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

R^7 là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl,

cũng như quy trình và các chất trung gian để điều chế chúng.

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất có công thức (II) hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (II) lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất trong đó thực vật này sinh trưởng.

Mô tả chi tiết sáng chế

Định nghĩa

Thuật ngữ " C_1 - C_6 -alkyl" được sử dụng trong bản mô tả này để chỉ hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh, bão hòa có 1, 2, 3, 4, 5 hoặc 6 nguyên tử cacbon. Ví dụ về C_1 - C_6 -alkyl bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, metyl, etyl, propyl (n-propyl), 1-metyletyl (iso-propyl), butyl (n-butyl), 1-metylpropyl (sec-butyl), 2-metylpropyl (iso-butyl), 1,1-dimetyletyl (tert-butyl), pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, 1,1-dimetylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, 1-metylpentyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 4-metylpentyl, 1,1-dimetylbutyl, 1,2-dimetylbutyl, 1,3-dimetylbutyl, 2,2-

dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl và 1-ethyl-2-methylpropyl. Cụ thể, mạch hydrocacbon này có 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử cacbon (“C₁-C₄-alkyl”), ví dụ, methyl, ethyl, propyl, iso-propyl, butyl, sec-butyl, iso-butyl hoặc tert-butyl.

Thuật ngữ “haloalkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này được hiểu tốt hơn là có nghĩa là alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như được định nghĩa ở trên, trong đó một hoặc nhiều phần tử thế hydro được thay thế theo cách giống hoặc khác với halogen. Đặc biệt tốt hơn là, haloalkyl này là, ví dụ clomethyl, flopropyl, flomethyl, diflomethyl, triclomethyl, 2,2,2-trifloethyl, pentaflloethyl, bromobutyl, triflomethyl, iodoethyl, và các chất đồng phân của chúng.

Thuật ngữ “xycloalkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này để chỉ vòng chứa cacbon đơn vòng không thơm, có 3 đến 8 nguyên tử cacbon. Các ví dụ về xycloalkyl no bao gồm nhưng không bị giới hạn ở nhóm xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl, xyclooctyl, xyclononyl và xyclodexyl.

Thuật ngữ “alkenyl” như được sử dụng trong bản mô tả này được hiểu tốt hơn là có nghĩa là alkenyl phân nhánh hoặc không phân nhánh, ví dụ nhóm vinyl, propen-1-yl, propen-2-yl, but-1-en-1-yl, but-1-en-2-yl, but-2-en-1-yl, but-2-en-2-yl, but-1-en-3-yl, 2-methyl-prop-2-en-1-yl, hoặc 2-methyl-prop-1-en-1-yl.

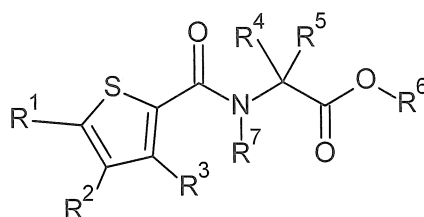
Thuật ngữ “alkynyl” như được sử dụng trong bản mô tả này được hiểu tốt hơn là có nghĩa là alkynyl phân nhánh hoặc không phân nhánh, ví dụ nhóm etynyl, prop-1-yn-1-yl, but-1-yn-1-yl, but-2-yn-1-yl, hoặc but-3-yn-1-yl.

Thuật ngữ “aryl” như được sử dụng trong bản mô tả này để chỉ hệ vòng hydrocacbon thơm, chứa từ 6 đến 15 nguyên tử cacbon, hoặc từ 6 đến 12 nguyên tử cacbon, tốt hơn là từ 6 đến 10 nguyên tử cacbon. Hệ vòng này có thể là hệ vòng thơm đơn vòng hoặc đa vòng ngưng tụ (ví dụ hai vòng hoặc ba vòng). Các ví dụ về aryl bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, phenyl, azulenyl, naphtyl và florenyl. Cũng hiểu rằng khi nhóm aryl này được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế, thì (các) phần tử thế này có thể là ở vị trí bất kỳ trên (các) vòng aryl này. Cụ thể, trong trường hợp aryl là nhóm phenyl, (các) phần tử thế này có thể chiếm giữ một hoặc cả hai vị trí ortho, một hoặc cả hai vị trí meta, hoặc vị trí para, hoặc tổ hợp bất kỳ của các vị trí này. Định nghĩa này cũng được áp dụng cho aryl là một phần của phần tử thế phức hợp (ví dụ aryloxy).

Thuật ngữ “aralkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này để chỉ C₁-C₆-alkyl được thế bằng aryl như được định nghĩa trong bản mô tả này. Các ví dụ về aralkyl bao gồm nhóm benzyl (-CH₂-C₆H₅).

Các hợp chất có công thức (II) như được thể hiện dưới đây được phát hiện là phòng trừ hữu hiệu các bệnh gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas* ở liều lượng thấp (tức là liều thấp tới 31 ppm) trong khi không thể hiện tác dụng diệt khuẩn trực tiếp.

Sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (II)



(II)

trong đó

R¹, R² và R³ là nguyên tử clo;

R⁴ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C₂-C₆-alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R⁵ là nguyên tử hydro; hoặc

R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R⁶ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl- C₃-C₈-xycloalkyl;

R⁷ là nguyên tử hydro hoặc C₁-C₆-alkyl.

Không được bao hàm trong bản mô tả này là các hợp chất thu được từ các tổ hợp chống lại các quy luật tự nhiên và người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này có thể loại trừ dựa trên kiến thức chuyên môn của họ. Ví dụ, các cấu trúc vòng có 3 hoặc nhiều hơn 3 nguyên tử oxy liền kề được loại trừ.

Tùy thuộc vào bản chất của phần tử thế, hợp chất có công thức (II) có thể xuất hiện ở dạng các chất đồng phân lập thể khác nhau. Các chất đồng phân lập thể này là, ví dụ, chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atrop hoặc chất đồng

phân hình học. Do đó, sáng chế bao gồm cả các chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ của các chất đồng phân này. Khi một hợp chất có thể xuất hiện trong hai hoặc nhiều dạng chất đồng phân ở trạng thái cân bằng, việc đề cập đến hợp chất này bằng cách mô tả một chất đồng phân được cho là bao gồm tất cả các dạng đồng phân.

Hợp chất bất kỳ theo sáng chế cũng có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng đồng phân hình học tùy thuộc vào số lượng liên kết đôi trong hợp chất. Các chất đồng phân hình học theo bản chất của phần tử thể xung quanh một liên kết đôi hoặc nhân có thể xuất hiện ở dạng *cis* (= *Z*-) hoặc *trans* (= *E*-). Do đó, theo cách tương tự, sáng chế đề cập đến tất cả các chất đồng phân hình học và tất cả các hỗn hợp có thể, theo mọi tỷ lệ.

Hợp chất có công thức (II) có thể thích hợp ở dạng tự do, dạng muối, dạng N-oxit hoặc dạng solvat của nó (ví dụ hydrat).

Tùy thuộc vào bản chất của phần tử thể, hợp chất có công thức (II) có thể xuất hiện ở dạng hợp chất tự do và/hoặc muối của nó, như muối hoạt tính hóa nông.

Muối hoạt tính hóa nông bao gồm muối cộng axit của axit vô cơ và hữu cơ cũng như muối của các bazơ thông thường. Ví dụ về axit vô cơ là axit hydrohalogenic, như hydro florua, hydro clorua, hydro bromua và hydro iodua, axit sulphuric, axit phosphoric và axit nitric, và muối axit, như natri bisulfat và kali bisulfat. Axit hữu cơ thích hợp là, ví dụ, axit formic, axit cacbonic và axit alkanoic, như axit axetic, axit trifloaxetic, axit tricloaxetic và axit propionic, và cả axit glycolic, axit thioxyanic, axit lactic, axit suxinic, axit xitric, axit benzoic, axit xinamic, axit oxalic, axit béo chưa bão hòa đơn hoặc hai chức hoặc bão hòa có 6 đến 20 nguyên tử cacbon, alkylsulfuric monoeste, axit alkylsulfonic (axit sulfonic có gốc alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh chứa 1 đến 20 nguyên tử cacbon), axit arylsulfonic hoặc axit aryldisulfonic (các gốc thơm, như phenyl và naphtyl, các gốc này chứa một hoặc hai nhóm axit sulfonic), axit alkylphosphonic (axit phosphonic có gốc alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh chứa 1 đến 20 nguyên tử cacbon), axit arylphosphonic hoặc axit aryldiphosphonic (các gốc thơm, như phenyl và naphtyl, các gốc này chứa một hoặc hai gốc axit phosphonic), trong đó, các gốc alkyl và aryl có thể chứa các phần tử thể khác, ví dụ, axit p-toluensulfonic, axit salixylic, axit p-aminosalixylic, axit 2-phenoxybenzoic, axit 2-axetoxybenzoic, v.v.

Solvat của hợp chất công thức (II) hoặc muối của chúng là hỗn hợp hóa học lượng pháp của hợp chất với các dung môi.

Các hợp chất có công thức (II) có thể tồn tại ở nhiều dạng tinh thể và/hoặc dạng vô định hình. Dạng tinh thể bao gồm dạng tinh thể chưa được solvat hóa, solvat và hydrat.

Theo một số phương án, trong công thức (I) nêu trên, R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C₂-C₆-alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro.

Các ví dụ không giới hạn về các nhóm R^4 thích hợp bao gồm nhóm bất kỳ trong số các nhóm R^4 được nêu trong cột “ R^4 ” của bảng II.1.

Theo một số phương án, trong công thức (II) nêu trên, R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, xyclopropyl, phenyl, benzyl, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl;

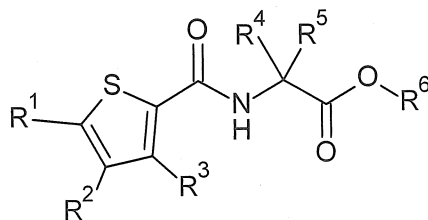
Các ví dụ không giới hạn về các nhóm R^6 thích hợp bao gồm nhóm bất kỳ trong số các nhóm R^6 được nêu trong cột “ R^6 ” của bảng II.1.

Theo một số phương án, trong công thức (II) nêu trên, R^7 là nguyên tử hydro hoặc metyl.

Các định nghĩa được nêu trên về R^4 , R^6 và R^7 có thể được kết hợp theo các cách khác nhau để tạo ra phân nhóm các hợp chất theo sáng chế.

Các ví dụ không giới hạn về phân nhóm các hợp chất bao gồm các phân nhóm được mô tả dưới đây.

Theo một số phương án, các hợp chất theo sáng chế là các hợp chất có công thức (II):



(II)

trong đó

R^1 , R^2 và R^3 là nguyên tử clo;

R^4 là nguyên tử hydro hoặc isobutyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl, tốt hơn là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_4 -alkyl, tốt hơn nữa là nguyên tử hydro, metyl hoặc etyl.

Các hợp chất có công thức (II) có thể được sử dụng để phòng trừ các bệnh do vi khuẩn, cụ thể để phòng trừ bệnh gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas*.

Quy trình điều chế các hợp chất có công thức (II)

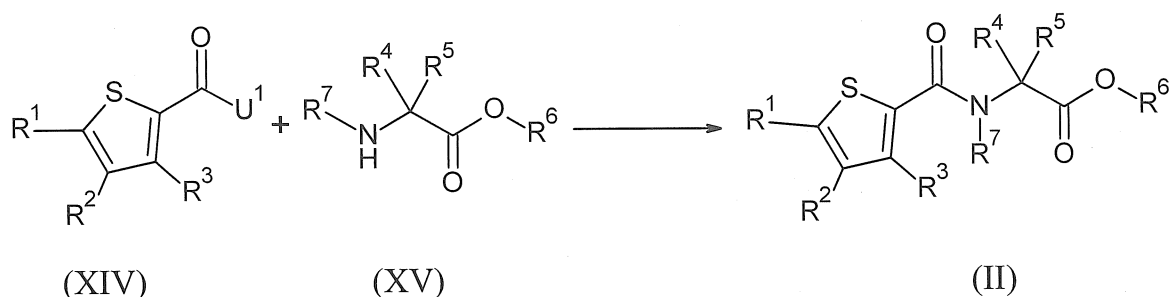
Sáng chế đề cập đến quy trình điều chế các hợp chất có công thức (II). Các hợp chất có công thức (II) có thể được điều chế bằng các con đường khác nhau tương tự với các quy trình đã biết (xem tài liệu tham khảo trong đó), và bằng một hoặc nhiều tuyến tổng hợp sau đây được mô tả dưới đây và trong phần thử nghiệm.

Cách tổng hợp chung với các hợp chất có công thức (II)

Trừ khi được chỉ định khác, dưới đây, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và R^7 có nghĩa như đã nêu trên đối với các hợp chất có công thức (II).

Quy trình A2

Các hợp chất có công thức (II) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình A2 mà bao gồm bước cho hợp chất có công thức (XIV) hoặc một trong số các muối của nó phản ứng với hợp chất có công thức (XV) hoặc một trong các muối của nó như được minh họa trên sơ đồ phản ứng sau:



Quy trình A2

trong đó U^1 là nguyên tử halogen, nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy.

Khi U^1 là nhóm hydroxy, quy trình A2 thuận lợi được thực hiện với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ. Các tác nhân ngưng tụ thích hợp có thể được chọn trong danh sách không nhằm giới hạn bao gồm chất tạo halogenua axit, như phosgen, phospho tribromua, phospho trichlorua, phospho pentachlorua, phospho trichlorua oxit, oxalyl clorua hoặc thionyl clorua; chất

tạo anhydrit, như etyl cloformat, metyl cloformat, isopropyl cloformat, isobutyl cloformat hoặc metansulfonyl clorua; carbodiimit, như N,N'-dixyclohexylcarbodiimit (DCC), N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-etylcarbodiimit hydroclorua (EDC) hoặc các tác nhân ngưng tụ thông thường khác, như phospho pentoxit, axit polyphosphoric, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic clorua, 1-[bis(dimethylamino)metylen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridini 3-oxid hexafluorophosphat (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylamín tetraflorolat (TBTU), (1-xyano-2-etoxi-2-oxoetylidenaminoxy)dimethylamino-morpholino-carbenium hexafluorophosphat, N,N'-carbonyl-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxycarbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/tetraclorua, 4-(4,6-dimetoxy[1,3,5]-triazin-2-yl)-4-metylmorpholin clorua hydrat, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic clorua (BOP-Cl), bromotripyrolidinophosphonihexafluorophosphat (PyBroP), 2-clo-1,3-dimetylimidazolini clorua (DMC) hoặc propanphosphonic anhydrit (T3P).

Khi U^1 là nguyên tử halogen, quy trình A2 thuận lợi được thực hiện với sự có mặt của chất kết dính axit. Các chất kết dính axit thích hợp để thực hiện quy trình A2 trong mỗi trường hợp là tất cả các bazơ vô cơ và hữu cơ thông thường cho các phản ứng như vậy. Ưu tiên các cacbonat kim loại kiềm, như xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, kali bicarbonat, natri bicarbonat, axetat kim loại kiềm thổ, như natri axetat, kali axetat, canxi axetat và amin bậc ba, như trimetylamín, trietylamin, diisopropyletylamín, tributylamin, N,N-dimetylanilin, N-metylpiperidin, N,N-dimetylpyridin-4-amin, diazabixyclooctan (DABCO), diazabixyclo-nonen (DBN) hoặc diazabixycloundexen (DBU), hoặc các bazơ thơm như pyridin.

Khi U^1 là nhóm C_1 - C_6 -alkoxy, quy trình A2 có thể được thực hiện với lượng dư thành phần amin, tùy ý có mặt axit Lewis như trimetylalumin.

Nếu thích hợp, quy trình A2 có thể được thực hiện với sự có mặt của bazơ và nếu thích hợp, với sự có mặt của dung môi, tốt hơn là trong điều kiện khan.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình A2 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ trơ thông thường miễn là nó không hòa tan hợp chất để phản ứng với nó hoặc thể hiện tương tác cụ thể bất kỳ với nó. Ưu tiên sử dụng các hydrocarbon béo, vòng béo hoặc thơm tùy ý được halogen hóa, như ete dầu mỏ, pentan, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin, ISOPARTM E hoặc ISOPARTM G clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc

tricloetan; các ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl *tert*-butyl ete, metyl *tert*-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 2-metyltetrahydrofuran, 1,2-dimetoxietan, 1,2-dietoxietan hoặc anisol; các nitril, như axetonitril, propionitril, *n*- hoặc *iso*-butyronitril hoặc benzonitril; các amit, như N,N-dimetylformamit, N,N-dimetylxetamit, N-metylformanilit, N-metylpyrrolidon hoặc hexametylphosphoric triamit; các ure, như 1,3-dimetyl-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pyrimidinon; các este, như metyl axetat hoặc etyl axetat, các sulfoxit, như dimetyl sulfoxit, hoặc các sulfon, như sulfolan; và hỗn hợp của các dung môi này.

Quy trình A2 có thể được thực hiện trong khí quyển trơ như khí quyển argon hoặc nitơ. Khi tiến hành quy trình A2, 1 mol hoặc lượng dư hợp chất có công thức (XV) và từ 1 đến 5 mol bazơ có thể được sử dụng trên mỗi mol hợp chất có công thức (XIV). Cũng có thể sử dụng các thành phần phản ứng theo tỷ lệ khác. Việc làm sạch được thực hiện bằng các phương pháp đã biết.

Các hợp chất có công thức (XV) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết rõ.

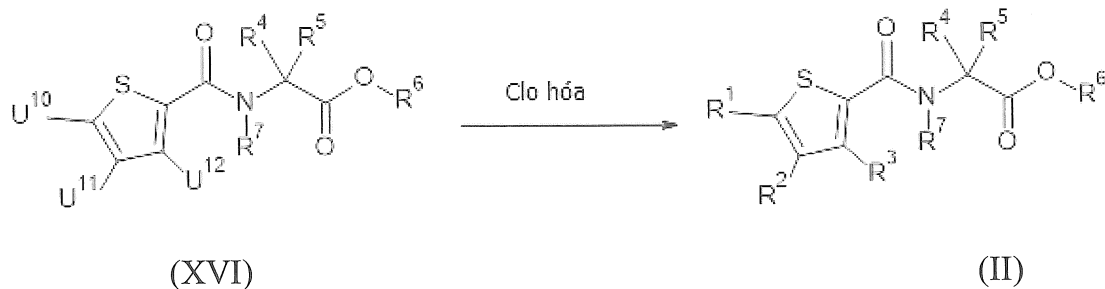
Các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là nhóm hydroxy có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là nhóm C₁-C₆-alkoxy bởi các quy trình đã biết rõ như thủy phân bazơ hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết (*Beilstein J. Org. Chem.* 2007, 3, No. 23)

Các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là halogen có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là nhóm hydroxy bằng các quy trình đã được biết rõ.

Các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là nhóm C₁-C₆-alkoxy có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIV) trong đó U¹ là nhóm hydroxy bằng các quy trình đã được biết rõ.

Quy trình B2

Các hợp chất có công thức (II) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình B2 từ hợp chất có công thức (XVI) hoặc một trong các muối của nó bằng cách thực hiện phản ứng clo hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:



Quy trình B2

trong đó U^{10} , U^{11} và U^{12} độc lập là nguyên tử hydro hoặc nguyên tử clo miễn là ít nhất một trong số U^{10} , U^{11} hoặc U^{12} là nguyên tử hydro.

Quy trình B2 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (WO2007098356).

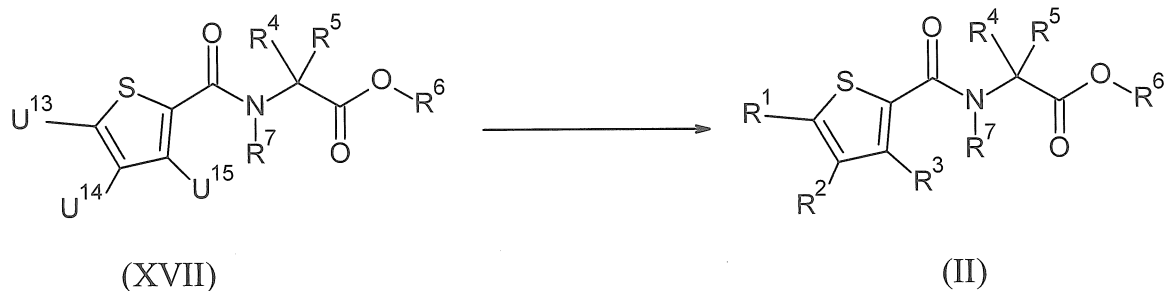
Quy trình B2 được thực hiện với sự có mặt của chất clo hóa và nếu thích hợp, với sự có mặt của dung môi.

Các chất clo hóa thích hợp để thực hiện quy trình B2 không bị giới hạn cụ thể miễn là chúng được sử dụng để clo hóa. Các ví dụ về các chất clo hóa bao gồm N-closuxinimit, sulfuryl clorua và 1,3-diclo-5,5-dimetyl-2,4-imidazolidindion.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình B2 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ trơ thông thường miễn là nó không hòa tan hợp chất để phản ứng với nó hoặc thể hiện tương tác cụ thể bất kỳ với nó. Các dung môi thích hợp có thể, chẳng hạn là các dung môi được bộc lộ liên quan đến quy trình A2. Để thực hiện quy trình B2, cũng có thể thuận lợi khi sử dụng axit hữu cơ như axit axetic làm dung môi hoặc đồng dung môi.

Quy trình C2

Các hợp chất có công thức (II) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình C2 bao gồm bước tiến hành diazo hóa hợp chất có công thức (XVII) hoặc một trong các muối của nó sau đó là thể thơm để tạo ra hợp chất có công thức (II) như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:

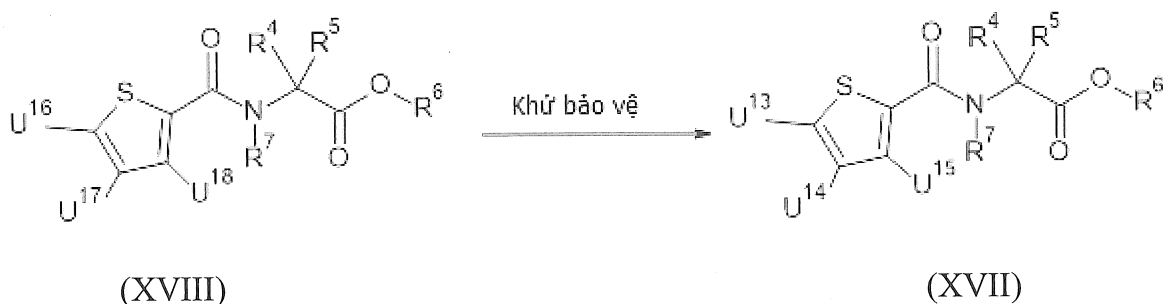


Quy trình C2

trong đó U^{13} , U^{14} và U^{15} độc lập là nhóm amino hoặc nguyên tử clo miễn là ít nhất một trong số U^{13} , U^{14} hoặc U^{15} là nhóm amino.

Quy trình C2 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280 and 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 và các tài liệu tham khảo được trích dẫn ở đây).

Các hợp chất có công thức (XVII) hoặc một trong các muối của nó như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình bao gồm bước khử bảo vệ hợp chất có công thức (XVIII) hoặc một trong các muối của nó như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:



trong đó

U^{13} , U^{14} và U^{15} độc lập là nhóm amino hoặc nguyên tử clo miễn là chỉ một trong số các gốc U^{13} , U^{14} hoặc U^{15} là nhóm amino,

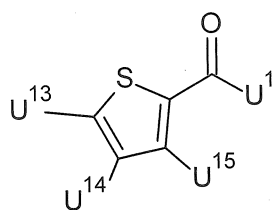
U^{16} , U^{17} và U^{18} độc lập là nhóm amino được bảo vệ hoặc nguyên tử clo miễn là ít nhất một trong số U^{16} , U^{17} hoặc U^{18} là nhóm amino được bảo vệ.

Các ví dụ về nhóm bảo vệ của nhóm amino bao gồm nhóm benzyl, nhóm 4-metoxymethyl, nhóm allyl, nhóm C_1 - C_6 -alkylsulfonyl không được thế hoặc được thế, trifluoromethylsulfonyl, phenylsulfonyl không được thế hoặc được thế, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl

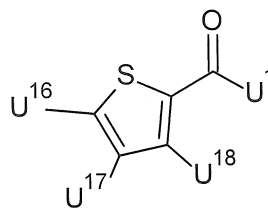
không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, alyloxycarbonyl, nhóm axetyl group hoặc nhóm trifloaxetyl.

Quy trình khử bảo vệ có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết để loại bỏ nhóm bảo vệ (Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194). Ví dụ, nhóm bảo vệ *tert*-butoxycarbonyl và benzyloxycarbonyl có thể được loại bỏ trong môi trường axit (ví dụ bằng axit clohydric hoặc axit trifloaxetic). Các nhóm bảo vệ benzylic có thể được loại bỏ bằng phương pháp thủy phân bằng hydro với sự có mặt của chất xúc tác (ví dụ paladi trên than hoạt tính). Nhóm trifloaxetyl có thể được loại bỏ trong môi trường bazơ (ví dụ bằng kali cacbonat hoặc lithi hydroxit).

Các hợp chất có công thức (XVII) cũng có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIX) và các hợp chất có công thức (XVIII) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XX) bằng phản ứng với hợp chất có công thức (XV) trong các điều kiện như được mô tả trong quy trình A2:



(XIX)



(XX)

trong đó U^{13} , U^{14} , U^{15} , U^{16} , U^{17} và U^{18} là như được mô tả ở đây và U^1 là nguyên tử halogen, nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy.

Các hợp chất có công thức (XIX) và các hợp chất có công thức (XX) là có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã được biết rõ với các điều kiện phản ứng tương tự như điều kiện được bộc lộ để điều chế các hợp chất có công thức (XIV).

Các hợp chất có công thức (II) hoặc một trong các muối của nó trong đó R^6 là nguyên tử hydro có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) trong đó R^6 là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl bằng các quy trình đã được biết rõ như thủy phân bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) trong đó R^6 là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-

$\text{Si}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl})_3$ và $\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl-xyclopropyl}$ có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) hoặc một trong các muối của nó trong đó R^6 là nguyên tử hydro bằng các quy trình đã được biết rõ.

Các hợp chất có công thức (II) hoặc một trong các muối của nó trong đó R^7 là $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$ có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) trong đó R^7 là nguyên tử hydro bằng các quy trình đã được biết rõ như alkyl hóa bằng cách sử dụng bazơ như natri hydrua và $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl halogenua}$.

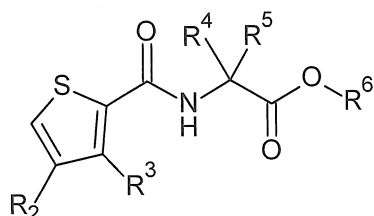
Các hợp chất trung gian như được bộc lộ ở đây có thể hữu hiệu trong việc phòng trừ vi khuẩn và/hoặc nấm.

Các hợp chất trung gian để điều chế các hợp chất có công thức (II)

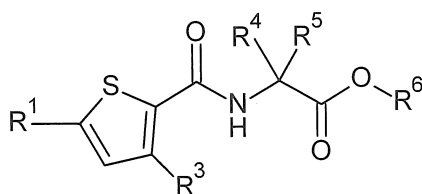
Sáng chế đề cập đến hợp chất trung gian để điều chế các hợp chất có công thức (II).

Trừ khi được chỉ định khác, dưới đây, $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6$ và R^7 có nghĩa như đã nêu trên đối với các hợp chất có công thức (II).

Các hợp chất có công thức (XVIa) và (XVIb) được cung cấp:



(XVIa)



(XVIb)

trong đó

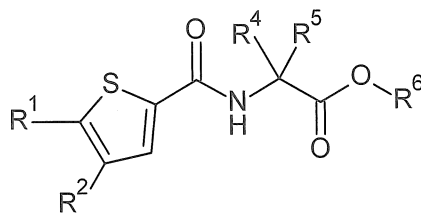
$\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3$ là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-xycloalkyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-xycloalkyl}$, aryl, aralkyl, $\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl-Si}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl})_3$ và $\text{-C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl-C}_3\text{-C}_8\text{-xycloalkyl}$.

Các hợp chất có công thức (XVIc):



(XVIc)

R^1 , R^2 , R^3 là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

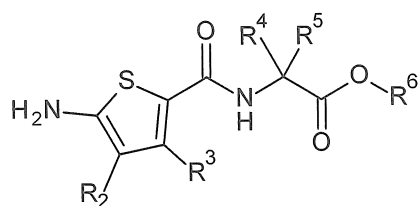
R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl)₃ và - C_1 - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

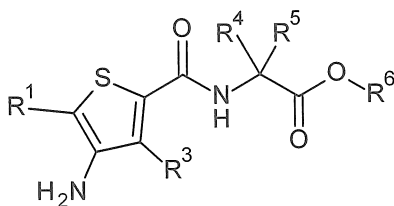
miễn là hợp chất có công thức (XVIc) không phải là:

- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin [138326-45-1],
- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxin [138326-47-3],
- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxin [138326-54-2],
- metyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxinat [138326-32-6],
- metyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxinat [138326-33-7],
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]valinat [138326-35-9],
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxinat [138326-36-0], và
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxinat [138326-37-1].

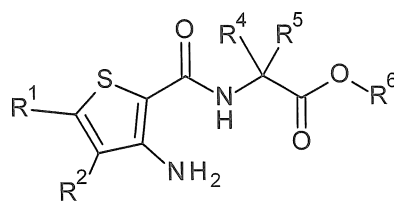
Các hợp chất có công thức (XVIIa), (XVIIb) và (XVIIc) được cung cấp:



(XVIIa)



(XVIIb)



(XVIIc)

trong đó

R^1, R^2, R^3 là nguyên tử clo;

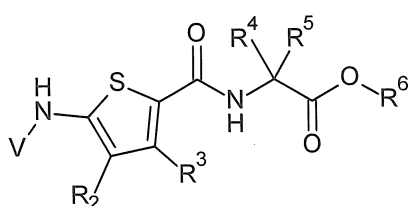
R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

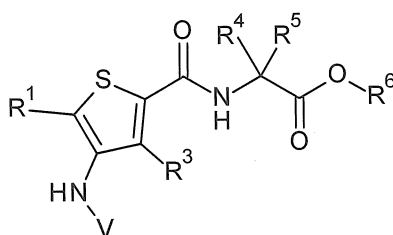
R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

trong đó R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro, khi R^6 là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl.

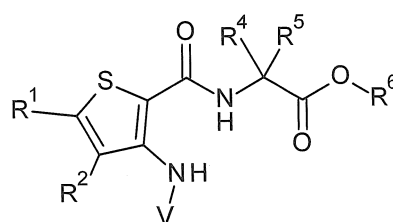
Các hợp chất có công thức (XVIIIa), (XVIIIb) và (XVIIIc) được cung cấp:



(XVIIIa)



(XVIIIb)



(XVIIIc)

trong đó

R^1, R^2, R^3 là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

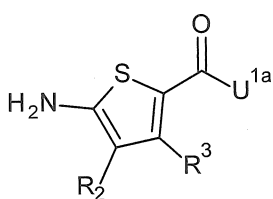
R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

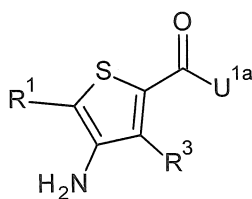
V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxycarbonyl, nhóm alyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, allyloxycarbonyl, nhóm axetyl hoặc nhóm trifloaxetyl;

trong đó R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro, khi R^6 là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl.

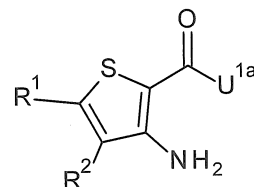
Các hợp chất có công thức (XIXa), (XIXb) và (XIXc) được cung cấp:



(XIXa)



(XIXb)



(XIXc)

trong đó

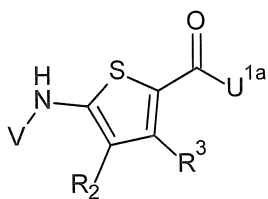
R^1 , R^2 , R^3 là nguyên tử clo;

U^{1a} là nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy,

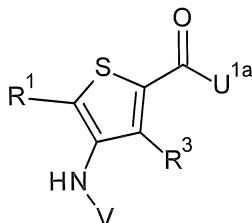
miễn là hợp chất có công thức (XIXc) không phải là:

- metyl 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylat [1621488-35-4].

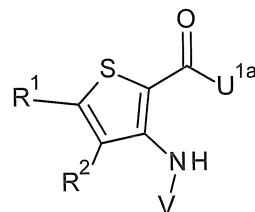
Các hợp chất có công thức (XXa), (XXb) và (XXc) được cung cấp:



(XXa)



(XXb)



(XXc)

trong đó

R^1, R^2, R^3 là nguyên tử clo;

V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxycarbonyl, nhóm alyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, allyloxycarbonyl, nhóm axetyl hoặc nhóm trifloaxetyl; và

U^{1a} là nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy,

miễn là hợp chất có công thức (XXc) không phải là:

Axit - 3-axetamido-4,5-diclothiophen-2-carboxylic [2090448-72-7],

- methyl 3-axetamido-4,5-diclothiophen-2-carboxylat [632356-39-9], và

- methyl 4,5-diclo-3-[(metoxycarbonyl)amino]thiophen-2-carboxylat [35707-28-9].

Các hợp chất trung gian được bộc lộ ở đây có thể hữu hiệu trong việc phòng trừ vi khuẩn và/hoặc nấm.

Chế phẩm và chế phẩm phối chế

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm, cụ thể chế phẩm phòng trừ các bệnh ở thực vật gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas* chứa một hoặc nhiều hợp chất có công thức (II) như được bộc lộ ở trên đây và hỗn hợp bất kỳ của chúng.

Chế phẩm này thường chứa ít nhất một hợp chất có công thức (II) và ít nhất một chất phụ trợ thích hợp trong nông nghiệp, ví dụ (các) chất mang và/hoặc (các) chất hoạt động bề mặt.

Chất mang là chất rắn hoặc lỏng, tự nhiên hoặc tổng hợp, hữu cơ hoặc vô cơ mà chúng thường ở dạng trơ. Chất mang thường cải thiện được việc áp dụng các hợp chất, chẳng hạn, lên thực vật, các bộ phận của thực vật hoặc hạt. Ví dụ về các chất mang rắn thích hợp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, muối amoni, bột đá tự nhiên, như cao lanh, đất sét, đá talc, đá phấn, thạch anh, attapulgit, montmorillonit và đất diatomit, và bột đá tổng hợp như silic oxit nghiền mịn, nhôm oxit và các silicat. Ví dụ về các chất mang rắn hữu dụng điển hình để tạo hạt mịn bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, đá tự nhiên nghiền và phân mảnh như canxit, đá hoa cương, đá bột, sepiolit, dolomit và các hạt mịn tổng hợp từ bột vô cơ và hữu cơ và hạt mịn từ vật liệu hữu cơ như giấy, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô và cuống thuốc lá. Ví dụ về các chất mang thích hợp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, nước, dung môi hữu cơ và tổ hợp của chúng. Ví dụ về các dung môi thích hợp bao gồm các chất lỏng hóa học hữu cơ

phân cực và không phân cực, ví dụ từ nhóm gồm các hydrocacbon thơm và không thơm (như xyclohexan, parafin, alkylbenzen, xylen, toluen alkylnaphtalen, các hydrocacbon thơm được clo hóa hoặc béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua), các rượu và rượu đa chức (mà tùy ý cũng có thể được thế, ete hóa và/hoặc este hóa, như butanol hoặc glycol), các keton (như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon), các este (bao gồm chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin không được thế và được thế, các amit (như dimetylformamit), các lactam (như N-alkylpyrolidon) và các lacton, sulfon và sulfoxit (như dimetyl sulfoxit). Chất mang cũng có thể là chất độn dạng khí hóa lỏng, tức là chất lỏng ở dạng khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và áp suất tiêu chuẩn, ví dụ các chất đẩy dạng sol khí như halohydrocarbon, butan, propan, nitơ và cacbon dioxit. Lượng chất mang điển hình nằm trong khoảng từ 1 đến 99,99%, tốt hơn nằm trong khoảng từ 5 đến 99,9%, tốt hơn nữa nằm trong khoảng từ 10 đến 99,5%, và tốt hơn nhất nằm trong khoảng từ 20 đến 99% theo khối lượng so với chế phẩm.

Chất hoạt động bề mặt có thể là chất hoạt động bề mặt ion (cation hoặc anion) hoặc không ion, như (các) chất nhũ hóa ion hoặc không ion, (các) chất tạo bọt, (các) chất phân tán, (các) chất tạo ẩm và hỗn hợp bất kỳ của các chất này. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt thích hợp bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, các muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulfonic, muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphtalensulfonic, sản phẩm trùng ngưng của etylen và/hoặc propylen oxit với rượu béo, axit béo hoặc amin béo (các este của polyoxyetylen và axit béo, các ete polyoxyetylen của rượu béo, ví dụ alkylaryl polyglycol ete), phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), muối của este của sulfosuccinic, dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), este phosphoric của rượu polyetoxyl hóa hoặc phenol, este béo của polyol, và dẫn xuất của hợp chất chứa sulfat, sulfonat và phosphat, (ví dụ alkylsulfonat, alkylsulfat, arylsulfonat) và dịch thủy phân protein, dịch thải lignosulphit và metylxenluloza. Chất hoạt động bề mặt thường được sử dụng khi hợp chất theo sáng chế và/hoặc chất mang không hòa tan trong nước và việc ứng dụng được thực hiện với nước. Khi đó, lượng chất hoạt động bề mặt thường nằm trong khoảng từ 5 đến 40% khối lượng của chế phẩm.

Các ví dụ khác về chất phụ trợ thích hợp bao gồm chất đẩy nước, chất hút ẩm, chất liên kết (chất kết dính, chất dính, tác nhân cố định, như carboxymetylxenluloza, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt mịn hoặc nhựa, như gôm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, các phospholipit tự nhiên như xephalin và lexithin và các phospholipit tổng

hợp, polyvinylpyrrolidon và tyloza), chất làm đặc, chất ổn định (ví dụ chất ổn định trong điều kiện lạnh, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng, hoặc các chất khác mà cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý), thuốc nhuộm hoặc chất màu (như chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và xanh Prussian; thuốc nhuộm hữu cơ, ví dụ alizarin, azo và thuốc nhuộm phtaloxyanin kim loại), chất chống tạo bọt (ví dụ chất chống tạo bọt silicon và magie stearat), chất bảo quản (ví dụ diclophen và rượu benzylic hemiformal), các chất làm đặc thứ cấp (các dẫn xuất xenluloza, các dẫn xuất axit acrylic, xanthan, đất sét biến tính và silic oxit nghiền mịn), chất kết dính, gibberelin và các chất phụ trợ gia công, các dầu khoáng và dầu thực vật, nước hoa, sáp, chất dinh dưỡng (bao gồm các chất dinh dưỡng vi lượng, như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molybden và kẽm), các chất keo bảo vệ, các chất thuận nghịch sol-gel, chất thấm, tác nhân chelat hóa và chất tạo phức.

Việc chọn các chất phụ trợ liên quan đến phương thức áp dụng dự định hợp chất có công thức theo sáng chế và/hoặc liên quan đến các đặc tính vật lý của nó. Ngoài ra, các chất phụ trợ có thể được chọn để truyền các đặc tính cụ thể (kỹ thuật, vật lý và/hoặc sinh học) cho các chế phẩm hoặc các dạng sử dụng được điều chế từ đó. Việc chọn các chất phụ trợ có thể cho phép tùy chỉnh các chế phẩm theo các nhu cầu cụ thể.

Chế phẩm theo sáng chế có thể ở dạng chế phẩm thông thường bất kỳ, như dung dịch (ví dụ, dung dịch nước), nhũ tương, bột thấm ướt, huyền phù gốc nước và gốc dầu, bột, bụi, hồ, bột hòa tan, hạt mịn hòa tan, hạt mịn dễ rắc, thể đặc huyền phù nhũ tương, các sản phẩm tự nhiên hoặc tổng hợp được tẩm (các) hợp chất theo sáng chế, phân bón và cả các vi nang trong các chất polyme. (Các) hợp chất theo sáng chế có thể có mặt ở dạng huyền phù, nhũ tương hoặc hòa tan.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được cung cấp cho người sử dụng cuối ở dạng phối chế sẵn sàng để sử dụng, tức là, chế phẩm có thể được áp dụng trực tiếp lên thực vật hoặc hạt bằng thiết bị thích hợp, như thiết bị phun hoặc phun mù. Theo cách khác, chế phẩm có thể được cung cấp cho người sử dụng cuối ở dạng thể đặc mà nó cần phải được pha loãng, tốt hơn là bằng nước, trước khi sử dụng.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được điều chế theo cách thông thường, ví dụ bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế với một hoặc nhiều chất phụ trợ thích hợp, như được bộc lộ ở trên.

Chế phẩm theo sáng chế thường chứa từ 0,01 đến 99% khối lượng, từ 0,05 đến 98% khối lượng, tốt hơn từ 0,1 đến 95% khối lượng, tốt hơn nữa từ 0,5 đến 90% khối lượng, tốt nhất từ 1 đến 80% khối lượng của (các) hợp chất theo sáng chế. Chế phẩm có thể bao gồm hai hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế. Trong trường hợp như vậy, các khoảng đã nêu để chỉ tổng lượng của các hợp chất theo sáng chế.

Các hỗn hợp/tổ hợp

(Các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được trộn với các hoạt chất khác như các chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, chất diệt cỏ, phân bón, chất điều hòa sinh trưởng, chất an toàn hoặc các hóa chất tín hiệu. Điều này có thể cho phép mở rộng phổ hoạt tính hoặc để ngăn ngừa sự phát triển tính kháng. Ví dụ về các chất diệt nấm, chất diệt côn trùng, chất diệt ve bét, chất diệt giun tròn và chất diệt khuẩn đã biết được bộc lộ trong tài liệu the Pesticide Manual, 17th Edition.

Ví dụ về các chất diệt nấm mà có thể được trộn với (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là:

1) Các chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.001) cyproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamin, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfat, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) prothioconazol, (1.019) pyrisoxazol, (1.020) spiroxamin, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-clo-

2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.036) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) Mefentrifluconazol, (1.056) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)metyl)xylopentanol, (1.060) 5-(allylsulfanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-

(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,2-trifloethoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,2-trifloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.069) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(pentafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-[(diflometyl)sulfanyl]phenoxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.075) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)ethoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.081) Ipfentrifluconazol.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp tại phức hợp I hoặc II, ví dụ (2.001) benzovindiflupyr, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr, (2.009) Isofetamid, (2.010) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (chất triệt quang dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp của chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng

syn-epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen, (2.020) Pyraziflumid, (2.021) sedaxan, (2.022) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.023) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.024) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.025) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.026) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamid, (2.027) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.028) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) Fluindapyr, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) isoflucypram, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-

5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.051) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.057) pyrapropoyn.

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp tại phức hợp III, ví dụ (3.001) ametoctradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) xyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017) pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019) pyraoxystrobin, (3.020) trifloxystrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{[(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy}phenyl)etyliden]amino} oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamit, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-{[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypyridin-2-yl}carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (3.026) mandestrobin, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamat, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamit, (3.029) metyl {5-[3-(2,4-dimetylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-metylbenzyl}cacbamat, (3.030) metyltetraprol, (3.031) florylpicoxamid.

4) Các chất ức chế nguyên phân và phân chia tế bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolide, (4.005) pencycuron, (4.006)

thiabendazol, (4.007) thiophanat-metyl, (4.008) zoxamit, (4.009) 3-clo-4-(2,6-diflophenyl)-6-metyl-5-phenylpyridazin, (4.010) 3-clo-5-(4-clophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-6-metylpyridazin, (4.011) 3-clo-5-(6-clopyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflophenyl)pyridazin, (4.012) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.013) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.014) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.015) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.016) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.017) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.018) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.019) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.020) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.021) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.022) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimetylpyridazin, (4.023) N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.024) N-(2-bromophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.025) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin.

5) Các hợp chất có tác động nhiều vị trí, ví dụ (5.001) hỗn hợp bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clothalonil, (5.005) đồng hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxyclorea, (5.009) đồng(2+) sulfat, (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram kẽm, (5.017) oxin-đồng, (5.018) propineb, (5.019) lưu huỳnh và chế phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etyl-5,7-dioxo-6,7-dihydro-5H-pyrol[3',4':5,6][1,4]dithiino[2,3-c][1,2]thiazol-3-carbonitril.

6) Các hợp chất cảm ứng cơ chế phòng vệ của vật chủ, ví dụ (6.001) acibenzolar-S-metyl, (6.002) isotianil, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.

7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.001) xyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin hydroclorua hydrat, (7.004) oxytetraxyclin, (7.005) pyrimethanil, (7.006) 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

8) Chất ức chế sản sinh ATP, ví dụ (8.001) silthiofam.

- 9) Các chất chế tổng hợp thành ức tế bào, ví dụ (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethomorph, (9.003) flumorph, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pyrimorph, (9.007) valifenalat, (9.008) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.009) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.
- 10) Các chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclofos-metyl.
- 11) Các chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.001) tricyclazol, (11.002) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamate.
- 12) Các chất ức chế tổng hợp axit nucleic, ví dụ (12.001) benalaxyl, (12.002) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.003) metalaxyl, (12.004) metalaxyl-M (mefenoxam).
- 13) Các chất ức chế truyền tín hiệu, ví dụ (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodion, (13.003) proxymidon, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.
- 14) Các hợp chất hoạt động dưới dạng chất phân tách, ví dụ (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.
- 15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazol, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimyxin, (15.005) carvon, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) xyflufenamid, (15.009) xymoxanil, (15.010) xyprosulfamid, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-aluminium, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothioxyanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomyxin, (15.018) natamixin, (15.019) niken dimetyldithiocacamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapirolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclophenol và các muối, (15.025) axit phosphor và muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetylát, (15.027) pyriofenon (chlazafenon), (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanit, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) dipymetitron, (15.035) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.036) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-

4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.037) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.038) 2-[6-(3-flo-4-metoxyphephenyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazoline, (15.039) 2-((5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.040) 2-((5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.041) Ipflufenquin, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenyl metansulfonat, (15.045) 2-phenylphenol và các muối, (15.046) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.047) quino-fumelin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng hồ biến: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic, (15.050) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.051) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen-2-sulfonohydrazit, (15.052) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.053) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.054) 9-flo-2,2-dimetyl-5-(quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepin, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino} oxy)metyl]pyridin-2-yl}cacbammat, (15.056) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, (15.057) axit phenazin-1-carboxylic, (15.058) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfat (2:1), (15.061) tert-butyl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino} oxy)metyl]pyridin-2-yl}cacbammat, (15.062) 5-flo-4-imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on, (15.063) aminopyrifen.

Tất cả các thành phần phối trộn đã biết thuộc nhóm (1) đến (15) mô tả trên đây có thể có mặt ở dạng hợp chất tự do và/hoặc ở dạng muối chấp nhận được trong nông nghiệp nếu nhóm chức của chúng cho phép.

Theo một số phương án, các tổ hợp hợp chất bao gồm các thành phần sau đây:

(II.01) + (1.001), (II.01) + (1.002), (II.01) + (1.003), (II.01) + (1.004), (II.01) + (1.005), (II.01) + (1.006), (II.01) + (1.007), (II.01) + (1.008), (II.01) + (1.009), (II.01) + (1.010), (II.01) +

(1.011), (II.01) + (1.012), (II.01) + (1.013), (II.01) + (1.014), (II.01) + (1.015), (II.01) +
 (1.016), (II.01) + (1.017), (II.01) + (1.018), (II.01) + (1.019), (II.01) + (1.020), (II.01) +
 (1.021), (II.01) + (1.022), (II.01) + (1.023), (II.01) + (1.024), (II.01) + (1.025), (II.01) +
 (1.026), (II.01) + (1.027), (II.01) + (1.028), (II.01) + (1.029), (II.01) + (1.030), (II.01) +
 (1.031), (II.01) + (1.032), (II.01) + (1.033), (II.01) + (1.034), (II.01) + (1.035), (II.01) +
 (1.036), (II.01) + (1.037), (II.01) + (1.038), (II.01) + (1.039), (II.01) + (1.040), (II.01) +
 (1.041), (II.01) + (1.042), (II.01) + (1.043), (II.01) + (1.044), (II.01) + (1.045), (II.01) +
 (1.046), (II.01) + (1.047), (II.01) + (1.048), (II.01) + (1.049), (II.01) + (1.050), (II.01) +
 (1.051), (II.01) + (1.052), (II.01) + (1.053), (II.01) + (1.054), (II.01) + (1.055), (II.01) +
 (1.056), (II.01) + (1.057), (II.01) + (1.058), (II.01) + (1.059), (II.01) + (1.060), (II.01) +
 (1.061), (II.01) + (1.062), (II.01) + (1.063), (II.01) + (1.064), (II.01) + (1.065), (II.01) +
 (1.066), (II.01) + (1.067), (II.01) + (1.068), (II.01) + (1.069), (II.01) + (1.070), (II.01) +
 (1.071), (II.01) + (1.072), (II.01) + (1.073), (II.01) + (1.074), (II.01) + (1.075), (II.01) +
 (1.076), (II.01) + (1.077), (II.01) + (1.078), (II.01) + (1.079), (II.01) + (1.080), (II.01) +
 (1.081), (II.01) + (1.082), (II.01) + (1.083), (II.01) + (1.084), (II.01) + (1.085), (II.01) +
 (1.086), (II.01) + (2.001), (II.01) + (2.002), (II.01) + (2.003), (II.01) + (2.004), (II.01) +
 (2.005), (II.01) + (2.006), (II.01) + (2.007), (II.01) + (2.008), (II.01) + (2.009), (II.01) +
 (2.010), (II.01) + (2.011), (II.01) + (2.012), (II.01) + (2.013), (II.01) + (2.014), (II.01) +
 (2.015), (II.01) + (2.016), (II.01) + (2.017), (II.01) + (2.018), (II.01) + (2.019), (II.01) +
 (2.020), (II.01) + (2.021), (II.01) + (2.022), (II.01) + (2.023), (II.01) + (2.024), (II.01) +
 (2.025), (II.01) + (2.026), (II.01) + (2.027), (II.01) + (2.028), (II.01) + (2.029), (II.01) +
 (2.030), (II.01) + (2.031), (II.01) + (2.032), (II.01) + (2.033), (II.01) + (2.034), (II.01) +
 (2.035), (II.01) + (2.036), (II.01) + (2.037), (II.01) + (2.038), (II.01) + (2.039), (II.01) +
 (2.040), (II.01) + (2.041), (II.01) + (2.042), (II.01) + (2.043), (II.01) + (2.044), (II.01) +
 (2.045), (II.01) + (2.046), (II.01) + (2.047), (II.01) + (2.048), (II.01) + (2.049), (II.01) +
 (2.050), (II.01) + (2.051), (II.01) + (2.052), (II.01) + (2.053), (II.01) + (2.054), (II.01) +
 (2.055), (II.01) + (2.056), (II.01) + (3.001), (II.01) + (3.002), (II.01) + (3.003), (II.01) +
 (3.004), (II.01) + (3.005), (II.01) + (3.006), (II.01) + (3.007), (II.01) + (3.008), (II.01) +
 (3.009), (II.01) + (3.010), (II.01) + (3.011), (II.01) + (3.012), (II.01) + (3.013), (II.01) +
 (3.014), (II.01) + (3.015), (II.01) + (3.016), (II.01) + (3.017), (II.01) + (3.018), (II.01) +
 (3.019), (II.01) + (3.020), (II.01) + (3.021), (II.01) + (3.022), (II.01) + (3.023), (II.01) +
 (3.024), (II.01) + (3.025), (II.01) + (3.026), (II.01) + (3.027), (II.01) + (3.028), (II.01) +

(3.029), (II.01) + (3.030), (II.01) + (4.001), (II.01) + (4.002), (II.01) + (4.003), (II.01) +
 (4.004), (II.01) + (4.005), (II.01) + (4.006), (II.01) + (4.007), (II.01) + (4.008), (II.01) +
 (4.009), (II.01) + (4.010), (II.01) + (4.011), (II.01) + (4.012), (II.01) + (4.013), (II.01) +
 (4.014), (II.01) + (4.015), (II.01) + (4.016), (II.01) + (4.017), (II.01) + (4.018), (II.01) +
 (4.019), (II.01) + (4.020), (II.01) + (4.021), (II.01) + (4.022), (II.01) + (4.023), (II.01) +
 (4.024), (II.01) + (4.025), (II.01) + (5.001), (II.01) + (5.002), (II.01) + (5.003), (II.01) +
 (5.004), (II.01) + (5.005), (II.01) + (5.006), (II.01) + (5.007), (II.01) + (5.008), (II.01) +
 (5.009), (II.01) + (5.010), (II.01) + (5.011), (II.01) + (5.012), (II.01) + (5.013), (II.01) +
 (5.014), (II.01) + (5.015), (II.01) + (5.016), (II.01) + (5.017), (II.01) + (5.018), (II.01) +
 (5.019), (II.01) + (5.020), (II.01) + (5.021), (II.01) + (5.022), (II.01) + (5.023), (II.01) +
 (6.001), (II.01) + (6.002), (II.01) + (6.003), (II.01) + (6.004), (II.01) + (7.001), (II.01) +
 (7.002), (II.01) + (7.003), (II.01) + (7.004), (II.01) + (7.005), (II.01) + (7.006), (II.01) +
 (8.001), (II.01) + (9.001), (II.01) + (9.002), (II.01) + (9.003), (II.01) + (9.004), (II.01) +
 (9.005), (II.01) + (9.006), (II.01) + (9.007), (II.01) + (9.008), (II.01) + (9.009), (II.01) +
 (10.001), (II.01) + (10.002), (II.01) + (10.003), (II.01) + (11.001), (II.01) + (11.002), (II.01)
 + (12.001), (II.01) + (12.002), (II.01) + (12.003), (II.01) + (12.004), (II.01) + (13.001), (II.01)
 + (13.002), (II.01) + (13.003), (II.01) + (13.004), (II.01) + (13.005), (II.01) + (13.006), (II.01)
 + (14.001), (II.01) + (14.002), (II.01) + (15.001), (II.01) + (15.002), (II.01) + (15.003), (II.01)
 + (15.004), (II.01) + (15.005), (II.01) + (15.006), (II.01) + (15.007), (II.01) + (15.008), (II.01)
 + (15.009), (II.01) + (15.010), (II.01) + (15.011), (II.01) + (15.012), (II.01) + (15.013), (II.01)
 + (15.014), (II.01) + (15.015), (II.01) + (15.016), (II.01) + (15.017), (II.01) + (15.018), (II.01)
 + (15.019), (II.01) + (15.020), (II.01) + (15.021), (II.01) + (15.022), (II.01) + (15.023), (II.01)
 + (15.024), (II.01) + (15.025), (II.01) + (15.026), (II.01) + (15.027), (II.01) + (15.028), (II.01)
 + (15.029), (II.01) + (15.030), (II.01) + (15.031), (II.01) + (15.032), (II.01) + (15.033), (II.01)
 + (15.034), (II.01) + (15.035), (II.01) + (15.036), (II.01) + (15.037), (II.01) + (15.038), (II.01)
 + (15.039), (II.01) + (15.040), (II.01) + (15.041), (II.01) + (15.042), (II.01) + (15.043), (II.01)
 + (15.044), (II.01) + (15.045), (II.01) + (15.046), (II.01) + (15.047), (II.01) + (15.048), (II.01)
 + (15.049), (II.01) + (15.050), (II.01) + (15.051), (II.01) + (15.052), (II.01) + (15.053), (II.01)
 + (15.054), (II.01) + (15.055), (II.01) + (15.056), (II.01) + (15.057), (II.01) + (15.058), (II.01)
 + (15.059), (II.01) + (15.060), (II.01) + (15.061), (II.01) + (15.062), (II.01) + (15.063), (II.01)
 + (15.064), (II.01) + (15.065), (II.01) + 15.066, (II.01) + (15.067), (II.01) + (15.068), (II.01)
 + (15.069), (II.01) + (15.070), (II.01) + (15.071), (II.01) + (15.072), (II.01) + (15.073), (II.01)

+ (15.074), (II.01) + (15.075), (II.01) + (15.076), (II.01), (II.01) + (15.077), (II.01) + (15.078), (II.01) + (15.079), (II.01) + (15.080), (II.01) + (15.081), (II.01) + (15.082), (II.01) + (15.083), (II.01) + (15.084), (II.01) + (15.085), (II.01) + (15.086), (II.01) + (15.087), (II.01) + (15.088), (II.01) + (15.089), (II.01) + (15.090), (II.01) + (15.091), (II.01) + (15.092), (II.01) + (15.093), (II.01) + (15.094), (II.01) + (15.095), (II.01) + (15.096), (II.01) + (15.097), (II.01) + (15.098), (II.01) + (15.099), (II.01) + (15.100), (II.01) + (15.101), (II.01) + (15.102), (II.01) + (15.103), (II.01) + (15.104), (II.01) + (15.105), (II.01) + (15.106), (II.01) + (15.107), (II.01) + (15.108), (II.01) + (15.109), (II.01) + (15.110), (II.01) + (15.111), (II.01) + (15.112). Trong các tổ hợp này, thành phần thứ nhất là hợp chất có công thức (II) như được xác định trong bảng II.1 (ví dụ II.01) và thành phần thứ hai là chất diệt nấm được chọn trong các nhóm từ 1 đến 15 như được định nghĩa trong bản mô tả này. Ví dụ, tổ hợp (II.01) + (1.001) tương ứng với tổ hợp bao gồm hợp chất II.01 trong Bảng II.1 và xyproconazol (1.001).

Theo một số phương án khác, các tổ hợp hợp chất tương ứng với các tổ hợp được mô tả ở trên trong đó hợp chất (II.01) được thay thế bằng một hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất được nêu trong Bảng II.1.

Các hợp chất có công thức (II), và chất diệt nấm được chọn từ nhóm (1) đến (15), có thể có mặt theo tỷ lệ khối lượng từ 100:1 đến 1:100 (hợp chất có công thức (II): chất diệt nấm được chọn từ nhóm (1) đến (15)), hoặc từ 50:1 đến 1:50, hoặc từ 20:1 đến 1:20. Các ví dụ tiếp theo về các phạm vi tỷ lệ khối lượng bao gồm 95:1 đến 1:95, 90:1 đến 1:90, 85:1 đến 1:85, 80:1 đến 1:80, 75:1 đến 1:75, 70:1 đến 1:70, 65:1 đến 1:65, 60:1 đến 1:60, 55:1 đến 1:55, 45:1 đến 1:45, 40:1 đến 1:40, 35:1 đến 1:35, 30:1 đến 1:30, 25:1 đến 1:25, 15:1 đến 1:15, 10:1 đến 1:10, 5:1 đến 1:5, 4:1 đến 1:4, 3:1 đến 1:3, 2:1 đến 1:2.

Chất diệt nấm khác được chọn trong các nhóm từ 1 đến 15 như được định nghĩa trong bản mô tả này có thể được bổ sung vào các chế phẩm tổ hợp.

(Các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng có thể được kết hợp với một hoặc nhiều tác nhân phòng trừ sinh học.

Các ví dụ về tác nhân phòng trừ sinh học có thể được kết hợp với (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là:

(A) Các chất kháng khuẩn được lựa chọn từ nhóm gồm:

(A1) vi khuẩn, như (A1.1) *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng QST713/AQ713 (có sẵn ở dạng SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO từ Bayer CropScience LP, US, có mã truy cập NRRL là B21661 và được mô tả trong patent Mỹ số 6,060,051); (A1.2) *Bacillus amyloliquefaciens*, đặc biệt là chủng D747 (có sẵn ở dạng Double Nickel™ từ Certis, US, có mã truy cập là FERM BP-8234 và được bộc lộ trong patent Mỹ số 7,094,592); (A1.3) *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng BU F-33 (có mã truy cập NRRL là 50185); (A1.4) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* chủng FZB24 (có sẵn ở dạng Taegro® từ Novozymes, US); (A1.5) chủng *Paenibacillus* sp. có mã truy cập là NRRL B-50972 hoặc mã truy cập là NRRL B-67129 và được mô tả trong công bố patent quốc tế số WO 2016/154297; và

(A2) nấm, như (A2.1) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là các bào tử chồi của chủng DSM14940; (A2.2) *Aureobasidium pullulans* các bào tử chồi của chủng DSM 14941; (A2.3) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là hỗn hợp của các bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM14941;

(B) Các chất diệt nấm được lựa chọn từ nhóm gồm:

(B1) vi khuẩn, ví dụ (B1.1) *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng QST713/AQ713 (có sẵn ở dạng SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO từ Bayer CropScience LP, US, có mã truy cập NRRL là B21661 và được mô tả trong patent Mỹ số 6,060,051); (B1.2) *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng QST2808 (có sẵn ở dạng SONATA® từ Bayer CropScience LP, US, có mã truy cập là NRRL B-30087 và được mô tả trong patent Mỹ số 6,245,551); (B1.3) *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng GB34 (có sẵn ở dạng Yield Shield® từ Bayer AG, DE); (B1.4) *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng BU F-33 (có mã truy cập NRRL là 50185); (B1.5) *Bacillus amyloliquefaciens*, đặc biệt là chủng D747 (có sẵn ở dạng Double Nickel™ từ Certis, US, có mã truy cập là FERM BP-8234 và được bộc lộ trong patent Mỹ số 7,094,592); (B1.6) *Bacillus subtilis* Y1336 (có sẵn ở dạng BIOBAC® WP từ Bion-Tech, Taiwan, được đăng ký là chất diệt nấm sinh học tại Đài Loan theo các số hiệu đăng ký số 4764, 5454, 5096 và 5277); (B1.7) *Bacillus amyloliquefaciens* chủng MBI 600 (có sẵn ở dạng SUBTILEX từ BASF SE); (B1.8) *Bacillus subtilis* chủng GB03 (có sẵn ở dạng Kodiak® từ Bayer AG, DE); (B1.9) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* chủng FZB24 (có sẵn từ Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia hoặc Syngenta bảo vệ cây trồng, LLC, Greensboro, North Carolina là chất diệt nấm TAEGRO® hoặc TAEGRO® ECO (đăng ký EPA số 70127-5); (B1.10) *Bacillus mycoides*, thể phân lập J (có sẵn ở dạng BmJ TGAi hoặc WG từ Certis USA); (B1.11) *Bacillus*

licheniformis, đặc biệt là chủng SB3086 (có sẵn ở dạng EcoGuard TM Biofungicide và Green Releaf từ Novozymes); (B1.12) chủng *Paenibacillus* sp. có mã truy cập là NRRL B-50972 hoặc mã truy cập là NRRL B-67129 và được mô tả trong công bố patent quốc tế số WO 2016/154297.

Trong một số phương án, tác nhân phòng trừ sinh học là chủng *Bacillus subtilis* hoặc *Bacillus amyloliquefaciens* mà chúng tạo ra hợp chất loại fengyxin hoặc plipastatin, hợp chất loại iturin và/hoặc hợp chất loại surfactin. Về kiến thức khái quát, xem trong bài viết tổng quan sau: Ongena, M., et al., “*Bacillus* Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol,” Trends in Microbiology, Vol 16, No. 3, March 2008, pp. 115-125. Chủng *Bacillus* có khả năng tạo ra các lipopeptit bao gồm *Bacillus subtilis* QST713 (có sẵn ở dạng SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO từ Bayer CropScience LP, US, có mã truy cập NRRL là B21661 và được mô tả trong patent Mỹ số 6,060,051), *Bacillus amyloliquefaciens* chủng D747 (có sẵn ở dạng Double Nickel™ từ Certis, US, có mã truy cập là FERM BP-8234 và được bộc lộ trong patent Mỹ số 7,094,592); *Bacillus subtilis* MBI600 (có sẵn ở dạng SUBTILEX® từ Becker Underwood, US EPA Reg. No. 71840-8); *Bacillus subtilis* Y1336 (có sẵn ở dạng BIOBAC® WP từ Bion-Tech, Taiwan, được đăng ký là chất diệt nấm sinh học tại Đài Loan theo các số hiệu đăng ký số 4764, 5454, 5096 và 5277); *Bacillus amyloliquefaciens*, đặc biệt là chủng FZB42 (có sẵn ở dạng RHIZOVITAL® từ ABiTEP, DE); và *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (có sẵn từ Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia hoặc Syngenta bảo vệ cây trồng, LLC, Greensboro, North Carolina là chất diệt nấm TAEGRO® hoặc TAEGRO® ECO (số hiệu đăng ký EPA số 70127-5); và

(B2) nấm, ví dụ: (B2.1) *Coniothyrium minitans*, đặc biệt là chủng CON/M/91-8 (mã truy cập số DSM-9660; ví dụ, Contans ® từ Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, đặc biệt là chủng NRRL Y-30752 (ví dụ, Shemer®); (B2.3) *Microsphaeropsis ochracea* (ví dụ, Microx® từ Propytha); (B2.5) *Trichoderma* spp., bao gồm *Trichoderma atroviride*, chủng SC1 được mô tả trong đơn đăng ký quốc tế số PCT/IT2008/000196); (B2.6) *Trichoderma harzianum* rifai chủng KRL-AG2 (cũng được biết là chủng T-22, /ATCC 208479, ví dụ, PLANTSHIELD T-22G, Rootshield®, và TurfShield từ BioWorks, US); (B2.14) *Gliocladium roseum*, chủng 321U từ W.F. Stoneman Company LLC; (B2.35) *Talaromyces flavus*, chủng V117b; (B2.36) *Trichoderma asperellum*, chủng ICC 012 từ Isagro; (B2.37) *Trichoderma asperellum*, chủng SKT-1 (ví dụ, ECO-HOPE® từ Kumiai Chemical Industry); (B2.38) *Trichoderma atroviride*,

chủng CNCM I-1237 (ví dụ, Esquive® WP từ Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, chủng số V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, chủng LC52 (ví dụ, Tenet bởi Agrimm Technologies Limited); (B2.44) *Trichoderma atroviride*, chủng ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) *Trichoderma atroviride*, chủng T11 (IMI352941/CECT20498); (B2.46) *Trichoderma harmatum*; (B2.47) *Trichoderma harzianum*; (B2.48) *Trichoderma harzianum rifai T39* (ví dụ, Trichodex® từ Makhteshim, US); (B2.49) *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là chủng KD (ví dụ, Trichoplus từ Biological Control Products, SA (thu được bởi Becker Underwood)); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, chủng ITEM 908 (ví dụ, Trianum-P từ Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, chủng TH35 (ví dụ, Root-Pro bởi Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (cũng được biết là *Gliocladium virens*), đặc biệt là chủng GL-21 (ví dụ, SoilGard 12G bởi Certis, US); (B2.53) *Trichoderma viride*, chủng TV1 (ví dụ, Trianum-P bởi Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, đặc biệt là chủng AQ 10 (ví dụ, AQ 10® bởi IntrachemBio Italia); (B2.56) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là các bào tử chồi của chủng DSM14940; (B2.57) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là các bào tử chồi của chủng DSM 14941; (B2.58) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là hỗn hợp của các bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM 14941 (ví dụ, Botector® bởi bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, chủng H39 (by Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (Synonym: *Clonostachys rosea f. catenulate*) chủng J1446 (ví dụ, Prestop® bởi AgBio Inc. và ví dụ, Primastop® bởi Kemira Agro Oy); (B2.70) *Lecanicillium lecanii* (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*) conidia của chủng KV01 (ví dụ, Vertalec® bởi Koppert/Arysta); (B2.71) *Penicillium vermiculatum*; (B2.72) *Pichia anomala*, chủng WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75) *Trichoderma atroviride*, chủng SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76) *Trichoderma atroviride*, chủng SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77) *Trichoderma atroviride*, chủng SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78) *Trichoderma gamsii* (trước đây là *T. viride*), chủng ICC080 (IMI CC 392151 CABI, ví dụ, BioDerma bởi AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, chủng DB 103 (ví dụ, T-Gro 7456 by Dagutat Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, chủng IMI 206039 (ví dụ, Binab TF WP bởi BINAB Bio-Innovation AB, Sweden); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (ví dụ, Tricovab bởi Ceplac, Brazil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, đặc biệt là chủng HRU3 (ví dụ, Botry-Zen® bởi

Botry-Zen Ltd, NZ); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (trước đây là *V. dahliae*), chủng WCS850 (CBS 276,92; ví dụ, Dutch Trig bởi Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) hỗn hợp của *Trichoderma asperellum* chủng ICC 012 và *Trichoderma gamsii* chủng ICC 080 (sản phẩm được biết là ví dụ, BIO-TAM™ từ Bayer CropScience LP, US).

Các ví dụ khác về tác nhân phòng trừ sinh học mà có thể được kết hợp với (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là:

vi khuẩn được chọn từ nhóm bao gồm *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 và *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (mã truy cập CNCM I-1582), *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (mã truy cập số NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), chủng AM65-52 (mã truy cập số ATCC 1276), *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là chủng ABTS-1857 (SD-1372), *B. thuringiensis subsp. kurstaki* chủng HD-1, *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* chủng NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Giun tròn *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (mã truy cập ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), và *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (mã truy cập NRRL 30232);

nấm và nấm men được lựa chọn từ nhóm gồm *Beauveria bassiana*, đặc biệt là chủng ATCC 74040, *Lecanicillium spp.*, đặc biệt là chủng HRO LEC 12, *Metarhizium anisopliae*, đặc biệt là chủng F52 (DSM3884 hoặc ATCC 90448), *Paecilomyces fumosoroseus* (hiện nay: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (mã truy cập ATCC 20874), và *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* chủng 251 (AGAL 89/030550);

Các virus được lựa chọn từ nhóm gồm *Adoxophyes orana* (bướm trái cây mùa hè) virus thể hạt (GV), *Cydia pomonella* (ấu trùng sâu bướm) virus thể hạt (GV), *Helicoverpa armigera* (sâu đục quả bông) virus đa diện nhân (NPV), *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (sâu xanh mùa thu) mNPV, và *Spodoptera littoralis* (sâu ăn lá bông châu Phi) NPV.

Vi khuẩn và nấm mà có thể được bổ sung làm “thành phần để cấy” lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc các cơ quan của thực vật và, nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ là: *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, đặc biệt là *Burkholderia cepacia* (trước đây được biết là *Pseudomonas*

cepacia), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, và *Streptomyces spp.*

các chất chiết và sản phẩm từ thực vật được tạo ra bởi các vi sinh vật bao gồm protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ phát mà có thể được sử dụng làm tác nhân phòng trừ sinh học, như *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (chất chiết saponin của *Chenopodium quinoa*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenone, *ryania/ryanodine*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, chất chiết *Brassicaceae*, đặc biệt là bột cải dầu hoặc bột mù tạc.

Các ví dụ về chất diệt côn trùng, chất diệt ve bét và chất diệt giun tròn, lần lượt, có thể được trộn với (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là:

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ như, các loại cacbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, metomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các phosphat hữu cơ, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, diclofos/DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazat, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoate, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon và vamidothion.

(2) Các chất phong bế kênh clorua qua cổng GABA, ví dụ như, các xyclodien-clo hữu cơ, ví dụ chlordan và endosulfan hoặc phenylpyrazol (các fiprol), ví dụ ethiprol và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ như các pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin s-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, chất đồng phân cyphenothrin [(1R)-trans], deltamethrin, chất đồng phân empenthrin [(EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momfloethrin, permethrin, phenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], prallethrin, các pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [chất đồng phân (1R)], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxychlor.

(4) Các chất điều biến cạnh tranh với thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic axetylcholine receptor - nAChR) ví dụ, các neonicotinoit, ví dụ, axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiametoxam hoặc nicotin hoặc sulfoxaflor hoặc flupyradifuron.

(5) Các chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nAChR), ví dụ các spinosyn, ví dụ spinetoram và spinosad.

(6) Các chất điều biến dị lập thể kênh clorua qua cổng glutamat (Glutamate-gated clorua channel - GluCl), ví dụ, các avermectin/milbemycin, ví dụ, abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất bắt chước hormone ấu trùng, ví dụ như, chất tương tự hormone ấu trùng, ví dụ, hydropren, kinopren và methopren hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các chất ức chế không đặc hiệu (nhiều vị trí) hỗn tạp, ví dụ, các alkyl halogenua, ví dụ, methyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc clopicrin hoặc sulphuryl florua hoặc thuốc gây nôn borax hoặc tartar hoặc chất tạo methyl isoxyanat, ví dụ diazomet và metam.

(9) Các chất điều biến cơ quan dây âm, ví dụ như pymetrozin hoặc flonicamid.

(10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét, ví dụ như clofentezin, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.

- (11) Các vi khuẩn phá vỡ màng ruột côn trùng, ví dụ như *Bacillus thuringiensis* loài phụ *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* phân loài *tenebrionis*, và các protein thực vật *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A,105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- (12) Các chất ức chế enzym tổng hợp ATP synthaza ty thể, như các chất phá hủy ATP, ví dụ như diafenthiuron hoặc các hợp chất hữu cơ thiếc, ví dụ azoxyclostin, xyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargit hoặc tetradifon.
- (13) Các chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách làm gián đoạn gradien proton, ví dụ như chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.
- (14) Các chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinic, ví dụ như bensultap, cartap hydroclorua, thioxylam, và thiosultap-natri.
- (15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 0, ví dụ như bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.
- (16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 1, ví dụ buprofezin.
- (17) Chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt đối với Diptera, tức là, côn trùng hai cánh), ví dụ như xyromazin.
- (18) Các chất chủ vận thụ thể hormone lột xác, ví dụ, chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit và tebufenozit.
- ((19) Các chất chủ vận octopamin, ví dụ, amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp III ty thể, ví dụ như hydrametylnon hoặc axequinoxyl hoặc fluacrypyrim.
- (21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp I ty thể, ví dụ như từ nhóm gồm chất diệt ve bét METI, ví dụ, fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenon (Derris).
- (22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế, ví dụ như indoxacarb hoặc metaflumizon.

(23) Các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, ví dụ như các dẫn xuất axit tetronic và tetramic, ví dụ, spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp IV ty thể, ví dụ như các phosphin, ví dụ nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua hoặc các xyanua, ví dụ canxi xyanua, kali xyanua và natri xyanua.

(25) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II ty thể, ví dụ như các dẫn xuất beta-ketonitril, ví dụ, xyenopyrafen và xyflumetofen và carboxanilit, ví dụ như pyflubumit.

(25) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II ty thể, ví dụ như các dẫn xuất beta-ketonitril, ví dụ, xyenopyrafen và xyflumetofen và carboxanilit, ví dụ như pyflubumit.

các hoạt chất khác, ví dụ như Afidopyropen, Afoxolaner, Azadirachtin, Benclothiaz, Benzoximat, Bifenazat, Broflanilide, Bromopropylat, Chinomethionat, cloprallethrin, Cryolit, Cyclaniliprol, xycloxaprid, Cyhalodiamide, Dicloromezotiaz, Dicofof, epsilon-Metofluthrin, epsilon-Momfluthrin, Flometoquin, Fluazaindolizin, Fluensulfon, Flufenerim, Flufenoxystrobin, Flufiprol, Fluhexafon, Fluopyram, Fluralaner, Fluxametamit, Fufenozit, Guadipyr, Heptafluthrin, Imidaclothiz, Iprodion, kappa-Bifenthrin, kappa-Tefluthrin, Lotilaner, Meperfluthrin, Paichongding, Pyridalyl, Pyrifluquinazon, Pyriminostrobin, Spirobudiclofen, Tetrametylfluthrin, Tetraniiprol, Tetrachlorantraniliprol, Tioxazafen, Thiofluoximat, Triflumezopyrim và iodometan; ngoài ra, các chế phẩm trên cơ sở *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và cả các hợp chất sau đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulphinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (được biết từ WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (được biết từ WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (được biết từ WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-on (được biết từ WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-yl etyl cacbonat (được biết từ EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpiperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (được biết từ WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (được biết từ JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (được biết từ WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-

[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflo-propan-2-on (được biết từ WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), *N*-[3-(benzylcarbamoyl)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafluoetyl)-4-(triflometyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-*N*-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (được biết từ CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*cis*-1-oxido-3-thietanyl)-benzamid, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*trans*-1-oxido-3-thietanyl)-benzamid và 4-[(5*S*)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*cis*-1-oxido-3-thietanyl)benzamid (được biết từ WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), *N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamid, (+)-*N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamid và (-)-*N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamid (được biết từ WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[*(2E)*-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-carbonitril (được biết từ CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-*N*-[4-clo-2-metyl-6-[(metylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit, (Liudaibenjiaxuanan, được biết từ CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); *N*-[4-clo-2-[(1,1-dimetyletyl)amino]carbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1*H*-Pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), *N*-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-diclo-4-[(3,3-diclo-2-propen-1-yl)oxy]phenoxy]propoxy]-2-metoxi-6-(triflometyl)-pyrimidin (được biết từ CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (*2E*)- và 2(*Z*)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-*N*-[4-(diflometoxy)phenyl]-hydrazincarboxamit (được biết từ CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); este của axit 3-(2,2-dicloetenyl)-2,2-dimetyl-4-(1*H*-benzimidazol-2-yl)phenyl-xyclopropanecarboxylic (được biết từ CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4*aS*)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[*(metoxycarbonyl)*4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]carbonyl]-indeno[1,2-*e*][1,3,4]oxadiazin-4*a*(3*H*)-carboxylic (được biết từ CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-*O*-etyl-2,4-di-*O*-metyl-, 1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoetoxy)phenyl]-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]- α -L-mannopyranoza (được biết từ US 2014/0275503 A1)

(CAS 1181213-14-8); 8-(2-xyclopropylmethoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3,2,1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-*anti*)-8-(2-xyclopropylmethoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3,2,1]octan (CAS 933798-27-7), (8-*syn*)-8-(2-xyclopropylmethoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3,2,1]octan (được biết từ WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]-propanamit (được biết từ WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và N-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(metyl amino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)-4-[[4-(triflometyl)phenyl]methoxy]-pyrimidin (được biết từ WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxyl-1-metyl-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-on (được biết từ WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxyl-1-metyl-1,8-diazaspiro[4,5]decan-2,4-dion (được biết từ WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etyl este của 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxyl-1-metyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-yl-carbonic (được biết từ WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit (được biết từ DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(E)]-N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit, (được biết từ WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(Z)]-N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit, (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-propoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[[5-(triflometyl)-2-pyridinyl]oxy]-9-azabixyclo[3,3,1]nonan (được biết từ WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

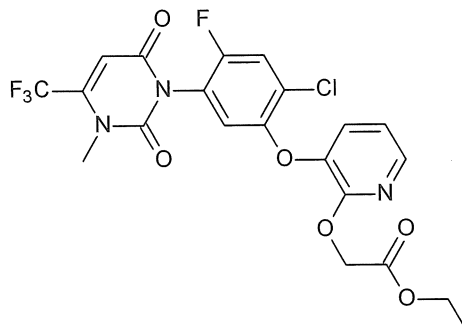
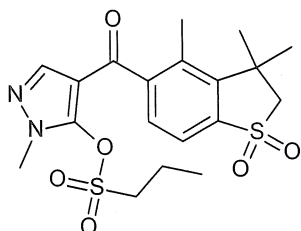
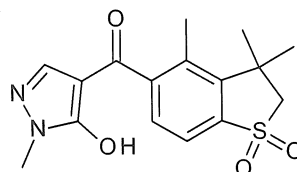
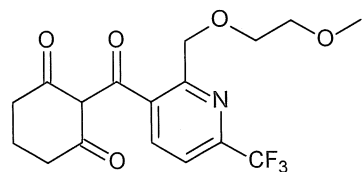
Ví dụ về chất an toàn mà có thể được kết hợp với các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), xyometrinil, xyprosulfamit, dichlormid, fenchlorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), naphtalic anhydrit, oxabetrinil, 2-metoxyl-N-({4-[(metylcarbamoyl)amino]phenyl}sulphonyl)benzamit (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Các ví dụ về chất diệt cỏ có thể trộn với (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế là:

Axetochlor, acifluorfen, acifluorfen-natri, aclonifen,alachlor, allidochlor, alloxydim, alloxydim-natri, ametryn, amicarbazon, amidochlor, amidosulfuron, axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metylphenyl)-5-flopyridin-2-carboxylic, aminoxyclopyrachlor, aminoxyclopyrachlor-kali, aminoxyclopyrachlor-metyl, aminopyralid, amitrol, ammonisulfamat, anilofos, asulam, atrazin, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-etyl, benfluralin, benfuresat, bensulfuron, bensulfuron-metyl, bensulid, bentazon, benzobixyclon, benzofenap, bixyclopyron, bifenox, bilanafos, bilanafos-natri, bispyribac, bispyribac-natri, bromacil, bromobutid, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil-butytrat, -kali, -heptanoat, và -octanoat, busoxinon, butachlor, butafenacil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylat, cafenstrol, carbetamit, carfentrazon, carfentrazon-etyl, chloramben, chlorbromuron, chlorfenac, chlorfenac-natri, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-metyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-etyl, chlorophthalim, chlorotoluron, chlorthal-dimetyl, chlorsulfuron, cinidon, cinidon-etyl, cinmetylin, cinosulfuron, clacyfos, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clomazon, clomeprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-metyl, cumyluron, cyanamid, cyanazin, xycloat, xyclopyrimorat, xyclosulfamuron, xycloxydim, cyhalofop, cyhalofop-butyl, cyprazin, 2,4-D, 2,4-D-butotyl, -butyl, -dimetylammoni, -diolamin, -etyl, -2-etylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylammoni, -kali, -triisopropanolammoni, và -trolamin, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimetylammoni, -isooctyl, -kali, và -natri, daimuron (dymron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosyl-pyrazolat (DTP), dicamba, dichlobenil, 2-(2,4-diclobenzyl)-4,4-dimetyl-1,2-oxazolidin-3-on, 2-(2,5-diclobenzyl)-4,4-dimetyl-1,2-oxazolidin-3-on, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclofop-metyl, diclofop-P-metyl, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, diflufenzopyr-natri, dimefuron, dimepiperat, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimetenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramin, dinoterb, diphenamid, diquat, diquat-dibromid, dithiopyr, diuron, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, etalfluralin, etametsulfuron, etametsulfuron-metyl, ethiozin, ethofumesat, etoxyfen, etoxyfen-etyl, etoxysulfuron, etobenzanid, F-9600, F-5231, tức là N-{2-clo-4-flo-5-[4-(3-flopropyl)-5-oxo-4,5-dihydro-1H-tetrazol-1-yl]phenyl}etansulfonamit, F-7967, tức là 3-[7-clo-5-flo-2-(triflometyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, fenoxaprop-P-etyl, fenoxasulfon, fenquinotrión, fentrazamid, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl,

flucarbazon, flucarbazon-natri, flucetosulfuron, fluchloralin, flufenacet, flufenpyr, flufenpyr-ethyl, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butyl, -dimetylammoni và -metyl, fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl, flupropanat, flupyr-sulfuron, flupyr-sulfuron-metyl-natri, fluridon, flurochloridon, fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl, flurtamon, fluthiacet, fluthiacet-metyl, fomesafen, fomesafen-natri, foramsulfuron, fosamin, glufosinat, glufosinat-amoni, glufosinat-P-natri, glufosinat-P-ammoni, glufosinat-P-natri, glyphosat, glyphosat-amoni, -isopropylamoni, -diamoni, -dimetylamoni, -kali, -natri, và -trimesium, H-9201, tức là O-(2,4-dimetyl-6-nitrophenyl) O-ethyl isopropylphosphoramidothioat, halauxifen, halauxifen-metyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-ethoxyetyl, haloxyfop-P-etoxyetyl, haloxyfop-metyl, haloxyfop-P-metyl, hexazinon, HW-02, tức là 1-(dimetoxylphosphoryl) ethyl-(2,4-diclophenoxy)axetat, imazametabenz, imazametabenz-metyl, imazamox, imazamox-amoni, imazapic, imazapic-amoni, imazapyr, imazapyr-isopropylamoni, imazaquin, imazaquin-amoni, imazethapyr, imazethapyr-imoni, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, ioxynil, ioxynil-octanoat, -kali và -natri, ipfencarbazon, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutol, karbutilat, KUH-043, tức là 3-({[5-(diflometyl)-1-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-yl]metyl}sulfonyl)-5,5-dimetyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, -isopropylamoni, -kali, và -natri, MCPB, MCPB-metyl, -etyl và -natri, mecoprop, mecoprop-natri, và -butotyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, và -kali, mefenacet, mefluidid, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, methabenzthiazuron, metam, metamifop, metamidron, metazachlor, metazosulfuron, methabenzthiazuron, methiopyrsulfuron, methiozolin, metyl isothioxyanat, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metyl, molinat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-este, MT-5950, tức là N-(3-clo-4-isopropylphenyl)-2-metyl-pentan amit, NGGC-011, napropamit, NC-310, tức là [5-(benzyloxy)-1-metyl-1H-pyrazol-4-yl](2,4-diclophenyl)metanon, neburon, nicosulfuron, axit nonanoic (axit pelargonic), norflurazon, axit oleic (axit béo), orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paraquat, paraquat diclorua, pebulat, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorophenol, pentoxazon, pethoxamit, dầu mỡ, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-metyl, prodiamin, profoxydim,

prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazin, propham, propisochlor, propoxycarbazon, propoxycarbazon-natri, propyrisulfuron, propyzamit, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen, pyraflufen-etyl, pyrasulfotol, pyrazolynat (pyrazolat), pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridat, pyriftalid, pyriminobac, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyrithiobac, pyrithiobac-natri, pyroxasulfon, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinclamin, quizalofop, quizalofop-etyl, quizalofop-P, quizalofop-P-etyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, sethoxydim, siduron, simazin, simetryn, SL-261, sulcotrion, sulfentrazon, sulfometuron, sulfometuron-metyl, sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, tức là 1-etoxy-3-metyl-1-oxobut-3-en-2-yl 5-[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]-2-nitrobenzoat, SYP-300, tức là 1-[7-flo-3-oxo-4-(prop-2-yn-1-yl)-3,4-dihydro-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-3-propyl-2-thioxoimidazolidin-4,5-dion, 2,3,6-TBA, TCA (axit triclo-roaxetic), TCA-natri, tebuthiuron, tefuryltrion, tembotrion, tepraloxym, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbuthylazin, terbutryn, thenylchlor, thiazopyr, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, thiobencarb, tiafenacil, tolpyralat, topramezon, tralkoxydim, triafamon, tri-alat, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tribenuron-metyl, triclopyr, trietazin, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-natri, trifludimoxazin, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, tritosulfuron, ure sulfat, vernolat, XDE-848, ZJ-0862, tức là 3,4-diclo-N-{2-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)oxy]benzyl}anilin, và các hợp chất sau đây:



Ví dụ về chất điều hòa sinh trưởng thực vật là:

Acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, axit 5-aminolevulinic, ancymidol, 6-benzylaminopurin, Brassinolid, catechin, chlormequat clorua, cloprop, xyclanilit, axit 3-(xycloprop-1-enyl) propionic, daminozide, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-natri, endothal, endothal-dikali, -dinatri, và -mono(N,N-dimetylalkylamoni), ethephon, flumetralin, flurenol, flurenol-butyl, flurprimidol, forchlorfenuron, axit giberelic, inabenfide, axit indol-3-axetic (IAA), axit 4-indol-3-ylbutyric, isoprothiolan, probenazol, axit jasmonic, maleic hydrazit, mepiquat clorua, 1-metylxcyclopropen, metyl jasmonat, 2-(1-naphtyl)axetamit, axit 1-naphtylaxetic, axit 2-naphtyloxyaxetic, hỗn hợp nitrophenolat, paclobutrazol, N-(2-phenyletyl)-beta-alanin, axit N-phenylphthalamic, prohexadion, prohexadion-canxi, prohydrojasmon, axit salixylic, strigolacton, tecnazen, thidiazuron, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etyl, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

Các phương pháp và sử dụng

(Các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có tiềm năng điều biến phòng vệ thực vật công hiệu. Chúng có thể được sử dụng để phòng trừ vi khuẩn không mong muốn, cụ thể vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas*. (Các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được dùng để bảo vệ các hạt giống, hạt nảy mầm, cây giống đã nhú, thực vật, các bộ phận của thực vật, quả, các sản phẩm thu hoạch và/hoặc đất trên đó các thực vật sinh trưởng khỏi các vi sinh vật không mong muốn.

Thuật ngữ phòng trừ hoặc việc phòng trừ như được sử dụng ở đây bao gồm việc phòng trừ mang tính ngăn chặn, bảo vệ, chữa trị và xử lý tận gốc các vi sinh vật không mong muốn.

Vì thế, sáng chế đề cập đến phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn gây ra bởi vi khuẩn thuộc chi *Xanthomonas* bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất theo sáng chế hoặc ít nhất một chế phẩm theo sáng chế lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc vào đất trên đó thực vật sinh trưởng.

Thông thường, khi (các) hợp chất và chế phẩm theo sáng chế được sử dụng trong các phương pháp chữa trị hoặc bảo vệ để phòng trừ các bệnh do vi khuẩn, lượng hiệu quả và tương thích với thực vật của nó được đưa lên thực vật, các bộ phận của thực vật, quả, hạt hoặc lên đất hoặc nền mà thực vật sinh trưởng trên đó. Các nền thích hợp mà có thể được sử dụng trong canh tác thực vật bao gồm các nền gốc vô cơ, như bông khoáng, đặc biệt là bông đá, peclit, cát hoặc sỏi; các nền hữu cơ, như than bùn, vỏ thông hoặc mùn cưa; và các nền gốc dầu mỡ như bột polyme hoặc hạt nhựa. Lượng hữu hiệu và-tương thích với thực vật nghĩa là

lượng đủ để phòng trừ vi khuẩn có mặt hoặc có khả năng xuất hiện trên đất trồng và mà không gây ra triệu chứng đáng kể nào về độc tính thực vật đối với cho cây trồng. Lượng như vậy có thể thay đổi trong phạm vi rộng phụ thuộc vào mầm bệnh được phòng trừ, loại cây trồng, giai đoạn sinh trưởng của cây trồng, điều kiện khí hậu và (các) hợp chất hoặc các chế phẩm theo sáng chế được sử dụng. Lượng này có thể được xác định bằng các thử nghiệm có hệ thống trên đồng ruộng mà nằm trong khả năng của người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực này. Các bệnh do mầm bệnh vi khuẩn, ví dụ loài *Xanthomonas* (ví dụ *Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*), loài *Pseudomonas* (ví dụ *Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*), loài *Erwinia* (ví dụ *Erwinia amylovora*) có thể được phòng trừ bằng các hợp chất theo sáng chế. Các hợp chất có công thức (II) cũng có thể có hiệu quả trong phòng trừ nấm gây bệnh ở thực vật trên cây.

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được dùng cho thực vật hoặc các bộ phận của thực vật bất kỳ.

Thực vật ở đây có nghĩa là tất cả thực vật và quần thể thực vật như thực vật đại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (gồm cả cây trồng xuất hiện một cách tự nhiên). Cây trồng có thể là thực vật thu được bằng cách nhân giống thông thường và các phương pháp tối ưu hóa hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và công nghệ di truyền hoặc sự kết hợp của các phương pháp này, bao gồm cả thực vật biến đổi gen (GMO hoặc thực vật chuyển gen) và giống cây trồng có khả năng được bảo vệ hoặc không có khả năng được bảo vệ bởi quyền của người chọn tạo giống cây trồng.

Thực vật biến đổi gen (Genetically modified plants - GMO)

Thực vật biến đổi gen (GMO hoặc thực vật chuyển gen) là thực vật mà một gen khác loại đã được tích hợp ổn định vào trong hệ gen của nó. Cách diễn đạt “gen khác loại” cơ bản nghĩa là gen mà được cung cấp hoặc được thu thập bên ngoài thực vật và khi được đưa vào trong hệ gen nhân, hệ gen lục lạp hoặc ty thể. Gen này mang đến cho thực vật chuyển dạng các đặc tính nông học mới hoặc đặc tính nông học được cải thiện hoặc các đặc tính khác bằng cách biểu hiện protein hoặc polypeptit mong muốn hoặc bằng cách điều chỉnh theo hướng làm giảm hoặc làm câm (các) gen khác mà chúng có mặt ở thực vật (ví dụ, sử dụng công nghệ đối nghĩa, công nghệ đồng ức chế, công nghệ can thiệp ARN – RNAi hoặc công nghệ ARN nhỏ – miRNA). Gen khác loại nằm trong hệ gen còn được gọi là gen chuyển. Gen chuyển

được xác định bởi vị trí cụ thể của nó trong hệ gen thực vật được gọi là sự biến nạp di truyền hoặc sự kiện chuyển gen.

Các giống thực vật được hiểu có là thực vật có các đặc tính ("tính trạng") mới và đã thu được bằng các kỹ thuật chọn giống thông thường, bằng kỹ thuật gây đột biến hoặc bằng kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Chúng có thể là giống cây trồng, giống thực vật, các kiểu sinh học hoặc kiểu gen

Các bộ phận của thực vật được hiểu nghĩa là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thể quả, quả, hạt, rễ, thân củ và thân rễ. Các bộ phận của thực vật cũng bao gồm vật liệu thu hoạch và vật liệu gây giống sinh dưỡng và sinh sản, ví dụ, cành giâm, thân củ, thân rễ, cành ghép và hạt.

Thực vật mà có thể được xử lý bằng phương pháp theo sáng chế bao gồm các thực vật sau: bông, lanh, nho, cây ăn quả, rau, như *Rosaceae sp.* (ví dụ cây dòng táo như táo và lê, nhưng cũng cả cây dạng quả hạch như mơ, anh đào, quả hạnh và đào, và cây dạng quả mềm như dâu tây), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (ví dụ chuối và các khu vườn thơm), *Rubiaceae sp.* (ví dụ cà phê), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (ví dụ chanh, cam và bưởi); *Solanaceae sp.* (ví dụ cà chua), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (ví dụ rau diếp), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (ví dụ dưa chuột), *Alliaceae sp.* (ví dụ tỏi tây, hành), *Papilionaceae sp.* (ví dụ đậu Hà Lan); các loại cây trồng chính, như *Gramineae sp.* (ví dụ ngô, vạt cỏ, ngũ cốc như lúa mì, lúa mạch đen, lúa, lúa mạch, yến mạch, kê và tiểu hắc mạch), *Asteraceae sp.* (ví dụ hướng dương), *Brassicaceae sp.* (ví dụ bắp cải trắng, bắp cải đỏ, cải xanh, súp lơ, cải tí hon Brussels, cải thìa pak Choi, su hào kohlrabi, củ cải đỏ, và cải dầu, mùa tạc, củ cải ngựa và cải xoong), *Fabaceae sp.* (ví dụ đậu, lạc), *Papilionaceae sp.* (ví dụ đậu nành), *Solanaceae sp.* (ví dụ khoai tây), *Chenopodiaceae sp.* (ví dụ củ cải đường, củ cải đường cho chăn nuôi, cải cầu vồng, củ dền); thực vật hữu dụng và thực vật làm cảnh cho các khu vườn và các khu vực lấy gỗ; và các giống biến đổi gen của mỗi một trong số các thực vật này.

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng phương pháp được mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật kháng lại một hoặc nhiều điều kiện bất lợi sinh học, tức là, thực vật này thể hiện khả năng phòng vệ tốt hơn chống lại động vật và vi sinh vật gây

hại, như chống lại giun tròn, côn trùng, ve bét, nấm gây bệnh cho thực vật, vi khuẩn, virus và/hoặc viroït.

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây là thực vật kháng lại một hoặc nhiều điều kiện bất lợi phi sinh học. Các điều kiện bất lợi phi sinh học có thể bao gồm, ví dụ, hạn hán, tiếp xúc với nhiệt độ lạnh, tiếp xúc nhiệt, điều kiện bất lợi về thẩm thấu, ngập lụt, độ mặn trong đất cao, tiếp xúc khoáng chất cao, tiếp xúc ozon, tiếp xúc ánh sáng cao, tình trạng sẵn có giới hạn về các chất dinh dưỡng nitơ, tình trạng sẵn có giới hạn của các chất dinh dưỡng phospho, tránh hiệu ứng bóng.

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây là thực vật đặc trưng bởi các đặc tính về năng suất cao. Năng suất cao ở thực vật này có thể là kết quả của, ví dụ, sinh lý thực vật được cải thiện, khả năng sinh trưởng và phát triển, như hiệu suất sử dụng nước, hiệu suất giữ nước, sử dụng nitơ tốt hơn, tăng đồng hóa cacbon, quang hợp được cải thiện, hiệu suất nảy mầm tăng và chín nhanh. Ngoài ra, năng suất có thể bị ảnh hưởng bởi kết cấu thực vật được cải thiện (trong các điều kiện bất lợi và không bất lợi), bao gồm nhưng không bị giới hạn ở, ra hoa sớm, kiểm soát ra hoa để sản xuất hạt lai, sức sống của cây con, kích cỡ thực vật, số lượng và khoảng cách giống, sinh trưởng rễ, kích thước hạt, kích thước quả, kích thước vỏ, số lượng vỏ hoặc bông, số lượng hạt trên mỗi vỏ hoặc bông, khối lượng hạt, tăng hạt mảy, giảm phân tán hạt, giảm tách vỏ và chống đổ rạp. Các tính trạng về năng suất khác bao gồm thành phần hạt, như hàm lượng và thành phần hydrat cacbon, ví dụ, bông hoặc tinh bột, hàm lượng protein, hàm lượng và thành phần dầu, giá trị dinh dưỡng, giảm thiểu các hợp chất kháng dinh dưỡng, khả năng chế biến cải thiện và độ ổn định khi bảo quản thích hợp hơn.

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây là thực vật lai đã thể hiện đặc tính về ưu thế lai hoặc sức lai mà thường dẫn đến năng suất, sức sống, sức khỏe và tính kháng lại các điều kiện bất lợi sinh học và phi sinh học cao hơn.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật mà chịu được chất diệt cỏ, tức là, thực vật chịu được một hoặc nhiều chất diệt cỏ nhất định. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền khả năng chịu chất diệt cỏ này.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật chuyển gen kháng côn trùng, tức là, thực vật được tạo tính kháng lại sự tấn công của các côn trùng đích nhất định. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền khả năng kháng côn trùng như vậy.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật chuyển gen kháng bệnh, tức là, thực vật được tạo tính kháng lại sự tấn công của các côn trùng đích nhất định. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền khả năng kháng côn trùng như vậy.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật mà chịu được các điều kiện bất lợi phi sinh học. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền tính chịu điều kiện bất lợi này.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật thể hiện số lượng, chất lượng và/hoặc độ ổn định bảo quản của sản phẩm thu hoạch thay đổi và/hoặc đặc tính của các thành phần đặc trưng của sản phẩm thu hoạch thay đổi.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật như cây bông, với các đặc tính sợi thay đổi. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền các đặc tính sợi thay đổi như vậy.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật, chẳng hạn như cây cải dầu hoặc cây thuộc họ Brassica liên quan với các đặc tính về dầu được thay đổi. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương

pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền các đặc tính về dầu thay đổi như vậy.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật như cải dầu hoặc cây Brassica có liên quan, với với các đặc tính vỡ hạt thay đổi. Thực vật như vậy có thể thu được bằng phương pháp biến nạp di truyền, hoặc bằng phương pháp chọn lọc thực vật chứa đột biến truyền các đặc tính vỡ hạt thay đổi như vậy và bao gồm thực vật như cây cải dầu với đặc tính vỡ hạt chậm hoặc giảm.

Thực vật và giống thực vật (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như kỹ thuật di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật như cây thuốc lá, với các đặc tính cải biến protein sau dịch mã thay đổi.

Các khía cạnh của sáng chế có thể được hiểu thêm dựa trên các ví dụ sau đây, các ví dụ này không được hiểu là để giới hạn phạm vi của các khía cạnh theo cách bất kỳ.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Tổng hợp hợp chất có công thức (II)

Ví dụ điều chế 1: Điều chế methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat (hợp chất II.01)

Dung dịch 250 mg (1,08 mmol) của axit 3,4,5-triclothiophen-2-carboxylic và 210 mg (1,67 mmol) của etyl glyxinat hydroclorua (1:1) được hòa tan trong 4,2 mL tetrahydrofuran được bổ sung 0,23 mL (1,62 mmol) triethylamin sau đó là 1,0 mL (1,68 mmol) dung dịch propanphosphonic anhydrit 50% (khối lượng/khối lượng) trong etyl axetat. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 20 giờ. Hỗn hợp phản ứng được ngừng phản ứng bằng nước và chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magie sulfat, được lọc và được cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (gradient *n*-heptane/etyl axetat) để thu được 178 mg (độ tinh khiết 93%, hiệu suất 51%) methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,8. (M+H) = 302.

Ví dụ điều chế 2: Điều chế *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin (hợp chất II.05)

Dung dịch chứa 178 mg (0,59 mmol) methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat được hòa tan trong 3 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt

1,3 mL dung dịch nước lithi hydroxit 1 M (1,3 mmol). Phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng etyl axetat, nước và dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa. Lớp hữu cơ được rửa hai lần bằng dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa. Lớp nước kết hợp được axit hóa một cách cẩn thận bằng dung dịch nước axit clohydric 37% (khối lượng/khối lượng) ở 0 °C và được chiết bằng etyl axetat. Lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magie sulfat, được lọc và cô trong áp suất giảm để thu được 159 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 92%) *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,14. (M-H) = 286.

Ví dụ điều chế 3: Điều chế etyl 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropan carboxylat (hợp chất II.02)

Bước 1: Điều chế etyl 1-{[(3-amino-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropan carboxylat (hợp chất XVIIc.01)

Dung dịch gồm 150 mg (0,60 mmol) axit 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylic hydroclorua (1:1) (hợp chất XIXc.01) và 255 mg (1,50 mmol) etyl 1-aminoxyclopropan carboxylat hydroclorua (1:1) được hòa tan trong 4,0 mL diclometan được bổ sung 0,45 mL (2,59 mmol) N,N-diisopropyletylamin sau đó là dung dịch chứa 255 mg (1,50 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazoloni clorua trong 2,0 mL diclometan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm ngừng bằng nước và được chiết bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magie sulfat, được lọc và được cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký lỏng điều chế hiệu năng cao (gradien axetonitril/dung dịch nước của axit formic (1%)) để thu được 69 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 35%) etyl 1-{[(3-amino-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropan carboxylat ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,77. (M+H) = 323.

Bước 2: Điều chế etyl 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropan carboxylat (hợp chất II.02)

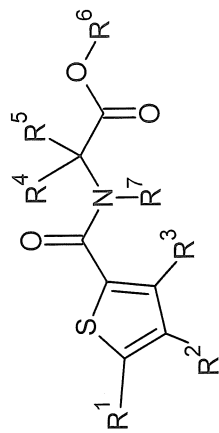
Dung dịch đồng(I) clorua (9,8 mg, 0,10 mmol) trong 0,5 mL axetonitril khan được bổ sung từng giọt *tert*-butyl nitrit (13 µL, 0,10 mmol) ở 0 °C. Hỗn hợp phản ứng được làm ấm đến nhiệt độ trong phòng trước khi bổ sung từng giọt dung dịch 25 mg (0,06 mmol) etyl 1-{[(3-amino-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropan carboxylat trong 0,5 mL axetonitril khan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 3 giờ. Hỗn hợp

phản ứng được pha loãng bằng diclometan và được axit hóa một cách cẩn thận với dung dịch nước axit clohydric 1 M. Lớp nước được chiết hai lần bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magie sulfat, được lọc và được cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký lỏng điều chế hiệu năng cao (gradien axetonitril/dung dịch nước axit formic (1%)) để thu được 12 mg (độ tinh khiết 93%, hiệu suất 48%) etyl 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino} xyclopropanecarboxylat ở dạng chất rắn màu be. $\text{LogP} = 3,40$. $(M) = 341$.

Các hợp chất minh họa

Các hợp chất theo sáng chế như được thể hiện trên các bảng II.1, II.2, II.3, II.4 và II.5 được điều chế tương tự như các ví dụ được cung cấp ở trên và/hoặc theo phần mô tả chung về các quy trình được bộc lộ trong bản mô tả này. Các hợp chất minh họa là hợp chất triệt quang trừ khi được quy định khác.

Bảng II.1 dưới đây minh họa các ví dụ không làm giới hạn về hợp chất theo có công thức (II).



(II)

Bảng II.1:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang*
II.01	Cl	Cl	Cl	H	H	Me	H	2,83 ^[a]		
II.02	Cl	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	H	3,41 ^[a]		
II.03	Cl	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H	2,06 ^[a]		
II.04	Cl	Cl	Cl	2-methylpropyl	H	Et	H	5,22 ^[a]		
II.05	Cl	Cl	Cl	H	H	H	H	2,16 ^[a]		
II.06	Cl	Cl	Cl	xyclopropyl	H	Me	H	3,81 ^[a]		
II.07	Cl	Cl	Cl	H	H	2,2,2-trifloetyl	H	3,60 ^[a]		
II.08	Cl	Cl	Cl	H	H	phenyl	H	3,87 ^[a]		
II.09	Cl	Cl	Cl	H	H	isopropyl	H	3,67 ^[a]		
II.10	Cl	Cl	Cl	H	H	propyl	H	3,70 ^[a]		
II.11	Cl	Cl	Cl	H	H	butyl	H	4,18 ^[a]		
II.12	Cl	Cl	Cl	H	H	xyclopropyl	H	3,33 ^[a]		
II.13	Cl	Cl	Cl	H	H	benzyl	H	4,11 ^[a]		

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang*
II.14	Cl	Cl	Cl	butan-2-yl	H	Me	H	4,82 ^[a]	(2S,3S)	
II.15	Cl	Cl	Cl	(4-hydroxyphenyl)methyl	H	Et	H	3,63 ^[a]		
II.16	Cl	Cl	Cl	H	H	cyclobutyl	H	3,87 ^[a]		
II.17	Cl	Cl	Cl	H	H	(Z)-hex-3-en-1-yl	H	4,69 ^[a]		
II.18	Cl	Cl	Cl	H	H	cyclopropylmethyl	H	3,81 ^[a]		
II.19	Cl	Cl	Cl	H	H	2-methylpropyl	H	4,13 ^[a]		
II.20	Cl	Cl	Cl	H	H	prop-2-yn-1-yl	H	3,13 ^[a]		
II.21	Cl	Cl	Cl	H	H	cyanomethyl	H	2,84 ^[a]		
II.22	Cl	Cl	Cl	H	H	allyl	H	3,64 ^[a]		
II.23	Cl	Cl	Cl	H	H	trimethylsilylmethyl	H	4,81 ^[a]		
II.24	Cl	Cl	Cl	H	H	tert-butyl	H	4,27 ^[b]		
II.25	Cl	Cl	Cl	benzyl	H	Et	H	5,00 ^[a]	(S)	+50,5° (c=1,03, CDCl ₃ , 25°C)
II.26	Cl	Cl	Cl	benzyl	H	Et	H	5,04 ^[a]		
II.27	Cl	Cl	Cl	2-methylpropyl	H	Et	H	5,20 ^[a]	(R)	-32° (c=1,13, CDCl ₃ , 25°C)
II.28	Cl	Cl	Cl	2-methylpropyl	H	Et	H	5,16 ^[a]	(S)	+13,8° (c=1,3, CDCl ₃ , 25°C)
II.29	Cl	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	H	3,04 ^[a]		
II.30	Cl	Cl	Cl	butan-2-yl	H	H	H	3,69 ^[a]	(2S,3S)	
II.31	Cl	Cl	Cl	2-methylpropyl	H	H	H	3,62 ^[a]		
II.32	Cl	Cl	Cl	benzyl	H	H	H	3,56 ^[a]		
II.33	Cl	Cl	Cl	cyclopropyl	H	H	H	2,83 ^[a]		
II.34	Cl	Cl	Cl	cyclopropyl	H	Et	H	4,30 ^[a]		

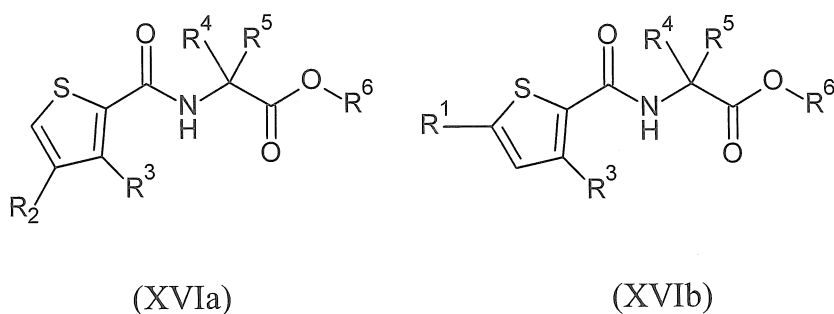
Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang*
II.35	Cl	Cl	Cl	H	H	Et	Me	3,21 ^[a]		
II.36**	Cl	Cl	Cl	-CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-		Me	H	3,68 ^[a]	*	
II.37	Cl	Cl	Cl	benzyl	H	Et	H	5,00 ^[a]	(R)	-39,6° (c=1,62, CDCl ₃ , 25°C)

Lưu ý: Me: methyl; Et: etyl

*Độ quay quang: nồng độ c được biểu diễn bằng g/100 mL; ** Hỗn hợp của các chất đồng phân lập thể

Các hợp chất trung gian ví dụ theo sáng chế như được thể hiện trên các bảng sau đây được điều chế tương tự như các ví dụ được cung cấp ở trên và/hoặc theo phân mô tả chung về các quy trình được bộc lộ trong bản mô tả này.

Bảng II.2 dưới đây minh họa theo cách không nhằm giới hạn các ví dụ về hợp chất trung gian theo công thức (XVIa) và (XVIb).

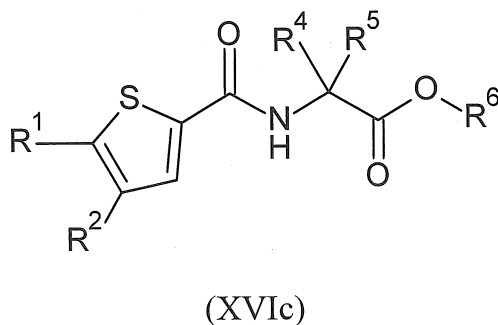


Bảng II.2:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP
XVIa.01	-	Cl	Cl	H	H	Et	2,40 ^[a]
XVIa.02	-	Cl	Cl	benzyl	H	Et	3,99 ^[a]
XVIa.03	-	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	2,59 ^[a]
XVIb.01	Cl	-	Cl	H	H	Et	2,37 ^[a]
XVIb.02	Cl	-	Cl	benzyl	H	Et	3,99 ^[a]
XVIb.03	Cl	-	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	2,55 ^[a]

Lưu ý: Et: etyl

Bảng II.3 dưới đây minh họa theo các không giới hạn các ví dụ về hợp chất trung gian theo công thức (XVIc).



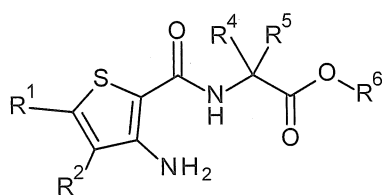
Bảng II.3:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP
XVIc.01	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	2,49 ^[a]
XVIc.02*	Cl	Cl	-CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-		Me	3,06 ^[a]
XVIc.03	Cl	Cl	cyclopropyl	H	Me	2,98 ^[a]
XVIc.04	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	2,77 ^[a]
XVIc.05	Cl	Cl	cyclopropyl	H	H	2,33 ^[a]
XVIc.06	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		H	2,01 ^[a]

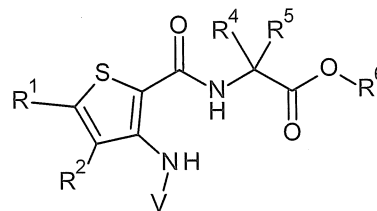
Lưu ý: Me: metyl; Et: etyl

* Hỗn hợp của các chất đồng phân lập thể

Bảng II.4 sau đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về hợp chất trung gian theo công thức (XVIIc).



(XVIIc)



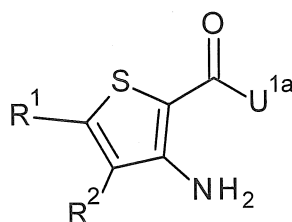
(XVIIIc)

Bảng II.4:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	V	LogP
XVIIc.01	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et		2,77 ^[a]
XVIIIc.01	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	<i>tert</i> -butoxycarbonyl	3,34 ^[a]

Lưu ý: Et: etyl

Bảng II.5 dưới đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về hợp chất trung gian theo công thức (XIXc).



(XIXc)

Bảng II.5:

Ví dụ số	R ¹	R ²	U ^{1a}	LogP
XIXc.01	Cl	Cl	OH	2,05 ^[a]

Trong các bảng trên, việc đo các giá trị LogP được tiến hành theo hướng dẫn EEC số 79/831 Annex V.A8 bằng phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao (High Performance Liquid Chromatography - HPLC) trên các cột pha đảo theo các phương pháp sau:

- ^[a] Giá trị logP được xác định bằng cách đo LC-UV, trong khoảng axit, với axit formic 0,1% trong nước và axetonitril làm dung môi rửa giải (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).
- ^[b] Giá trị logP được xác định bằng cách đo LC-UV, trong khoảng trung tính, với dung dịch amoni axetat 0,001 M trong nước và axetonitril làm dung môi rửa giải (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).
- ^[c] Giá trị LogP được xác định bằng cách đo LC-UV, trong khoảng axit, với axit phosphoric 0,1% và axetonitril làm chất giải hấp (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

Nếu nhiều hơn 1 giá trị LogP có giá trị trong cùng phương pháp, thì tất cả các giá trị được xác định và được phân tách bằng ký hiệu “+”.

Việc hiệu chuẩn được tiến hành bằng các alkan-2-on mạch thẳng (từ 3 đến 16 nguyên tử cacbon) với các giá trị LogP đã biết (đo các giá trị LogP sử dụng các thời gian duy trì bằng phép nội suy tuyến tính giữa các alkanon kế tiếp). Các giá trị Lambda-max được xác định bằng cách sử dụng phổ UV từ 200nm đến 400nm và các giá trị đỉnh của các tín hiệu sắc ký.

Danh sách đỉnh NMR

Bảng A cung cấp dữ liệu NMR (¹H) của một số hợp chất được bọc lộ trong các bảng trên.

Dữ liệu ¹H-NMR của các ví dụ lựa chọn được ghi ở dạng danh sách liệt kê đỉnh ¹H-NMR. Đối với mỗi đỉnh tín hiệu có liệt kê giá trị δ theo ppm và cường độ tín hiệu trong ngoặc tròn. Giữa các cặp giá trị δ – cường độ tín hiệu là dấu chấm phẩy làm dấu phân tách.

Danh mục đỉnh làm ví dụ do đó có dạng:

δ_1 (cường độ₁); δ_2 (cường độ₂);.....; δ_i (cường độ_i);.....; δ_n (cường độ_n)

Cường độ của các tín hiệu rõ nét tương ứng với độ cao của các tín hiệu trong ví dụ được in ra về phổ NMR tính bằng cm và thể hiện các mối quan hệ thực của các cường độ tín hiệu. Từ các tín hiệu rộng, một số đỉnh hoặc giá trị trung bình của tín hiệu và cường độ tương đối của chúng so với tín hiệu cường độ cao nhất trong phổ có thể được thể hiện.

Để hiệu chuẩn độ dịch chuyển hóa học đối với phổ ^1H , các tác giả sử dụng tetrametylsilan và/hoặc sử dụng độ dịch chuyển hóa học của dung môi, nhất là trong trường hợp phổ được đo trong DMSO. Do đó, trong danh sách liệt kê đỉnh NMR, đỉnh tetrametylsilan có thể xuất hiện nhưng không nhất thiết.

Bảng liệt kê đỉnh ^1H -NMR là tương tự như trong bản in ^1H -NMR cổ điển và do đó, thường chứa tất cả các đỉnh mà các đỉnh này được liệt kê ở phần diễn giải NMR cổ điển.

Ngoài ra, các bảng này có thể thể hiện giống như các tín hiệu in ^1H -NMR của các dung môi, chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích, các hợp chất này cũng là đối tượng của sáng chế và/hoặc đỉnh của các tạp chất.

Để thể hiện các tín hiệu hợp chất trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, các đỉnh thường dùng của dung môi, ví dụ các đỉnh DMSO trong DMSO- D_6 và đỉnh của nước được thể hiện trong bảng liệt kê đỉnh ^1H -NMR của tác giả sáng chế và thường lấy giá trị trung bình của cường độ cao.

Các đỉnh của chất đồng phân lập thể của hợp chất đích và/hoặc các đỉnh của tạp chất thường có giá trị trung bình của cường độ thấp hơn các đỉnh của hợp chất đích (ví dụ, với độ tinh khiết >90%).

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc tạp chất có thể là điển hình trong quy trình điều chế cụ thể. Do đó, các đỉnh của chúng có thể giúp nhận diện sự mô phỏng quy trình của tác giả sáng chế thông qua “các dấu ấn sản phẩm phụ”.

Chuyên gia sẽ tính toán các đỉnh của hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, và cả bằng các giá trị kỳ vọng đánh giá theo kinh nghiệm) có thể tách riêng các đỉnh của hợp chất đích khi cần tùy ý sử dụng các bộ lọc cường độ. Việc

tách này có thể sẽ tương tự như việc chọn đỉnh thích hợp trong cách diễn giải $^1\text{H-NMR}$ cổ điển.

Mô tả chi tiết về dữ liệu NMR với danh sách liệt kê đỉnh có thể xem trong ấn phẩm “Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”, Research Disclosure Database Number 564025.

Bảng A: Danh sách liệt kê đỉnh NMR

II.01: $^1\text{H-NMR}$(499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,6002 (0,7); 8,5890 (1,4); 8,5779 (0,8); 4,0685 (4,7); 4,0569 (4,8); 3,6736 (16,0); 2,5043 (0,4); 2,5011 (0,3)
II.02: $^1\text{H-NMR}$(300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,4036 (1,8); 7,2986 (3,0); 4,2389 (2,4); 4,2151 (7,5); 4,1914 (7,6); 4,1676 (2,5); 1,7275 (2,1); 1,7106 (6,0); 1,6998 (6,1); 1,6845 (2,7); 1,6388 (3,0); 1,3739 (2,8); 1,3586 (6,2); 1,3477 (6,2); 1,3308 (2,2); 1,2923 (8,0); 1,2685 (16,0); 1,2447 (7,7); 0,0325 (3,7)
II.03: $^1\text{H-NMR}$(499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,5814 (2,4); 8,7865 (14,0); 3,6061 (0,4); 3,5976 (0,5); 3,5930 (1,0); 3,5885 (0,5); 3,5799 (0,4); 2,5065 (1,2); 2,5031 (1,5); 2,4997 (1,1); 1,7630 (0,5); 1,7567 (0,6); 1,7499 (1,2); 1,7432 (0,6); 1,7369 (0,5); 1,4652 (0,8); 1,4348 (6,7); 1,4252 (15,1); 1,4187 (16,0); 1,4100 (6,6); 1,3784 (0,6); 1,2628 (0,3); 1,2495 (0,4); 1,2313 (0,4); 1,2175 (0,5); 1,1965 (1,0); 1,1648 (7,6); 1,1560 (15,8); 1,1495 (15,3); 1,1400 (5,6); 1,1095 (0,4)
II.04: $^1\text{H-NMR}$(300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,4464 (1,1); 7,4208 (1,1); 7,2982 (1,2); 4,8273 (0,8); 4,8112 (0,4); 4,8004 (2,0); 4,7823 (0,9); 4,7739 (1,3); 4,7639 (0,3); 4,7561 (0,6); 4,2982 (2,0); 4,2744 (6,4); 4,2506 (6,7); 4,2269 (2,3); 1,8300 (0,9); 1,8117 (1,3); 1,8062 (0,8); 1,7932 (1,0); 1,7806 (2,5); 1,7735 (1,8); 1,7646 (2,0); 1,7581 (1,7); 1,7430 (2,4); 1,7284 (1,1); 1,7167 (1,5); 1,7113 (0,9); 1,6889 (0,9); 1,4536 (0,9); 1,3552 (7,9); 1,3449 (0,4); 1,3314 (16,0); 1,3076 (7,8); 1,2843 (0,5); 1,2780 (0,5); 1,0372 (0,6); 1,0189 (9,3); 1,0134 (11,5); 1,0060 (7,5); 0,9983 (10,7); 0,9930 (8,4); 0,9613 (0,3); 0,9022 (0,4); 0,0213 (1,0)
II.05: $^1\text{H-NMR}$(499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,7883 (1,2); 8,4631 (6,8); 3,9636 (16,0); 3,9550 (15,4); 3,3294 (6,5); 2,4988 (5,9)
II.06: $^1\text{H-NMR}$(400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,7679 (0,8); 8,7508 (0,8); 3,8014 (1,0); 3,7842 (1,0); 3,7783 (1,0); 3,7610 (1,0); 3,6813 (16,0); 3,3322 (31,0); 2,5125 (5,0); 2,5080 (10,4); 2,5033 (13,8); 2,4987 (10,0); 2,4942 (4,8); 1,2741 (0,6); 1,2627 (0,6); 1,2511 (0,6); 1,2392 (0,6); 1,2311 (0,4); 0,6263 (0,5); 0,6174 (0,6); 0,6125 (0,5); 0,6054 (0,4); 0,6026 (0,6); 0,5974 (0,3); 0,5915 (0,4); 0,5816 (0,4); 0,5519 (0,4); 0,5481 (0,4); 0,5387 (0,5); 0,5318 (0,4); 0,5280 (0,5); 0,5182 (0,6); 0,4967 (0,5); 0,4829 (0,4); 0,4735 (0,7); 0,4613 (0,8); 0,4502 (0,6); 0,4065 (0,4); 0,3950 (0,5); 0,3831 (0,6); 0,3705 (0,6); 0,3611 (0,3)

II.07: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4814 (1,6); 7,2987 (4,9); 4,6610 (3,8); 4,6335 (11,5); 4,6060 (11,6); 4,5785 (3,9); 4,4125 (16,0); 4,3949 (15,8); 1,6310 (2,7); 1,2890 (0,6); 0,0339 (5,1)

II.08: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6120 (2,6); 7,4669 (4,1); 7,4611 (2,1); 7,4418 (9,8); 7,4151 (7,4); 7,3289 (3,8); 7,3040 (5,5); 7,2990 (4,0); 7,2796 (1,9); 7,1915 (8,5); 7,1878 (10,6); 7,1623 (8,3); 4,5518 (16,0); 4,5350 (15,8); 1,6992 (0,4); 1,2954 (0,6); 0,0401 (1,6)

II.09: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5673 (0,6); 7,2989 (0,8); 5,1972 (0,4); 5,1763 (1,0); 5,1554 (1,4); 5,1345 (1,0); 5,1136 (0,4); 4,2375 (5,2); 4,2214 (5,2); 1,3391 (16,0); 1,3182 (15,9); 0,0264 (0,8)

II.10: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5607 (1,0); 7,2988 (3,5); 4,2879 (10,1); 4,2716 (10,0); 4,2343 (4,8); 4,2119 (9,9); 4,1896 (5,0); 1,8025 (0,6); 1,7781 (2,3); 1,7549 (4,7); 1,7308 (4,9); 1,7075 (2,7); 1,6835 (0,8); 1,6555 (0,7); 1,2876 (0,4); 1,0257 (8,2); 1,0010 (16,0); 0,9762 (7,2); 0,1125 (0,7); 0,1061 (0,7); 0,0326 (3,1)

II.11: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5588 (1,2); 7,2988 (3,0); 4,2786 (11,2); 4,2626 (10,6); 4,2524 (10,2); 4,2302 (5,0); 1,7443 (1,0); 1,7211 (3,0); 1,7124 (1,1); 1,6984 (3,7); 1,6720 (3,2); 1,6498 (1,4); 1,4942 (0,7); 1,4696 (2,2); 1,4440 (3,3); 1,4186 (3,4); 1,4017 (0,6); 1,3945 (2,1); 1,3705 (0,7); 1,2863 (0,4); 1,0040 (8,2); 0,9796 (16,0); 0,9551 (6,5); 0,0313 (2,0)

II.12: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5454 (0,7); 7,2990 (2,2); 4,3171 (0,4); 4,3063 (0,5); 4,3013 (0,9); 4,2964 (0,6); 4,2854 (1,4); 4,2759 (0,8); 4,2708 (0,8); 4,2685 (0,7); 4,2647 (0,6); 4,2479 (7,5); 4,2315 (7,4); 0,8276 (0,9); 0,8159 (5,2); 0,8134 (5,4); 0,8056 (2,1); 0,7989 (16,0); 0,0312 (1,9)

II.13: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5492 (1,1); 7,4393 (0,6); 7,4293 (1,6); 7,4157 (24,7); 7,3935 (0,7); 7,3871 (0,7); 7,2990 (4,9); 5,2796 (16,0); 4,3335 (8,8); 4,3170 (8,8); 1,2936 (0,6); 0,0388 (4,6)

II.14: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,4879 (0,8); 8,4686 (0,8); 4,3850 (1,0); 4,3689 (1,2); 4,3660 (1,2); 4,3499 (1,0); 3,6820 (16,0); 3,3261 (19,3); 2,5254 (0,5); 2,5206 (0,7); 2,5119 (8,8); 2,5075 (18,2); 2,5029 (24,0); 2,4983 (17,6); 2,4938 (8,6); 1,9663 (0,4); 1,9613 (0,3); 1,9553 (0,4); 1,9499 (0,5); 1,9446 (0,4); 1,9387 (0,3); 1,9333 (0,4); 1,4838 (0,4); 1,4724 (0,4); 1,4686 (0,5); 1,4574 (0,4); 1,4499 (0,4); 1,4387 (0,4); 1,2882 (0,4); 1,2698 (0,6); 1,2665 (0,5); 1,2538 (0,5); 1,2478 (0,6); 1,2362 (0,7); 1,2138 (0,3); 0,9135 (5,9); 0,8962 (6,6); 0,8752 (6,2); 0,8566 (2,5); -0,0002 (3,4)

II.15: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,2545 (6,6); 8,4347 (2,1); 8,4161 (2,1); 7,9525 (0,6); 7,0523 (5,7); 7,0313 (6,5); 6,6853 (0,9); 6,6785 (7,0); 6,6574 (6,6); 4,5849 (0,7); 4,5710 (1,0); 4,5635 (1,4); 4,5513 (1,2); 4,5446 (1,1); 4,5307 (0,8); 4,1422 (1,5); 4,1366 (0,5); 4,1246 (4,6); 4,1072 (4,6); 4,0973 (0,4); 4,0900 (1,6); 3,3310 (27,2); 3,0779 (0,9); 3,0644 (1,0); 3,0432 (2,0); 3,0297 (1,9); 2,9974 (2,0); 2,9752 (1,9); 2,9628 (1,0); 2,9405 (0,9); 2,8908 (4,3); 2,7317 (3,9); 2,5115 (16,6); 2,5074 (32,8); 2,5029 (43,1); 2,4984 (32,1); 2,4941 (16,2); 1,2383 (1,0); 1,1901 (7,7); 1,1724 (16,0); 1,1546 (7,4); -0,0002 (5,1)

II.16: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5444 (1,9); 7,2988 (3,2); 5,1740 (0,6); 5,1498 (2,4); 5,1244 (3,5); 5,0998 (2,4); 5,0757 (0,6); 4,2524 (16,0); 4,2362 (15,8); 2,4686 (1,0); 2,4595 (1,5); 2,4498 (1,3); 2,4421 (1,9); 2,4356 (2,8); 2,4333 (2,8); 2,4270 (3,1); 2,4183 (2,9); 2,4093 (3,2); 2,4006 (3,6); 2,3941 (2,6); 2,3866 (1,8); 2,3766 (2,0); 2,3680 (1,6); 2,2298 (0,8); 2,2274 (0,8); 2,2199 (0,6); 2,2014 (1,6); 2,1953 (3,4); 2,1860 (2,2); 2,1753 (1,3); 2,1691 (3,4); 2,1624 (3,6); 2,1607 (3,6); 2,1536 (2,9); 2,1366 (2,5); 2,1275 (2,9); 2,1224 (1,6); 2,1037 (0,9); 2,0957 (0,8); 2,0932 (0,8); 2,0400 (1,0); 1,9302 (0,5); 1,9238 (0,8); 1,9215 (0,8); 1,9152 (0,5); 1,8876 (2,0); 1,8616 (1,2); 1,8542 (2,0); 1,8441 (1,0); 1,8300 (0,5); 1,8272 (0,5); 1,8210 (0,8); 1,8183 (0,8); 1,8121 (0,5); 1,7628 (0,9); 1,7360 (1,6); 1,7302 (1,4); 1,7277 (1,5); 1,7089 (1,1); 1,7021 (2,8); 1,6955 (1,5); 1,6723 (1,4); 1,6658 (2,1); 1,6589 (0,7); 1,6397 (1,0); 1,6318 (0,9); 1,6048 (0,4); 1,2842 (1,0); 0,0293 (2,6)

II.17: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5067 (1,1); 7,2620 (7,1); 5,5609 (0,4); 5,5580 (0,6); 5,5551 (0,4); 5,5463 (0,8); 5,5434 (1,3); 5,5401 (1,0); 5,5365 (0,9); 5,5329 (0,7); 5,5288 (0,8); 5,5251 (1,0); 5,5219 (1,4); 5,5189 (0,8); 5,5102 (0,4); 5,5073 (0,7); 5,5044 (0,4); 5,3328 (0,5); 5,3298 (0,8); 5,3267 (0,5); 5,3182 (0,9); 5,3152 (1,5); 5,3119 (1,1); 5,3083 (0,8); 5,3042 (0,7); 5,3005 (0,9); 5,2970 (1,0); 5,2936 (1,2); 5,2905 (0,7); 5,2821 (0,4); 5,2790 (0,6); 4,2414 (9,9); 4,2316 (9,9); 4,2255 (4,8); 4,2117 (9,0); 4,1978 (4,4); 2,4521 (1,3); 2,4507 (1,3); 2,4493 (1,3); 2,4370 (3,3); 2,4355 (3,3); 2,4237 (3,2); 2,4225 (3,2); 2,4099 (1,1); 2,4086 (1,0); 2,4072 (1,0); 2,0901 (0,6); 2,0885 (0,6); 2,0872 (0,7); 2,0751 (2,2); 2,0736 (2,1); 2,0723 (2,2); 2,0602 (3,2); 2,0588 (3,1); 2,0574 (3,1); 2,0453 (2,2); 2,0440 (2,1); 2,0424 (2,1); 2,0303 (0,6); 2,0290 (0,6); 2,0275 (0,6); 1,5675 (3,2); 0,9888 (8,3); 0,9737 (16,0); 0,9586 (7,6); 0,0063 (0,6); -0,0002 (8,5)

II.18: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5667 (1,5); 7,2986 (22,3); 4,3113 (16,0); 4,2951 (15,8); 4,0974 (14,1); 4,0728 (14,4); 2,9949 (1,6); 2,9225 (1,3); 1,5968 (10,9); 1,2905 (1,3); 1,2728 (0,4); 1,2568 (0,6); 1,2478 (0,8); 1,2411 (0,5); 1,2318 (1,5); 1,2212 (1,2); 1,2162 (1,0); 1,2054 (2,4); 1,1949 (1,0); 1,1893 (1,3); 1,1791 (1,6); 1,1700 (0,4); 1,1632 (0,9); 1,1541 (0,6); 1,1382 (0,4); 0,6817 (1,7); 0,6657 (4,8); 0,6611 (5,8); 0,6575 (3,7); 0,6454 (2,5); 0,6384 (5,6); 0,6345 (4,6); 0,6188 (2,1); 0,5961 (0,3); 0,3781 (2,2); 0,3624 (6,8); 0,3464 (5,2); 0,3424 (6,7); 0,3266 (1,4); 0,0470 (0,8); 0,0438 (0,4); 0,0362 (26,0); 0,0269 (0,7); 0,0253 (1,0)

II.19: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5566 (0,5); 7,2983 (1,3); 4,2964 (4,6); 4,2802 (4,5); 4,0449 (4,7); 4,0227 (4,8); 2,0606 (0,4); 2,0383 (0,9); 2,0158 (1,1); 1,9935 (0,9); 1,9712 (0,5); 1,6501 (0,8); 0,9991 (16,0); 0,9767 (15,3); 0,0313 (1,3)

II.20: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5248 (1,4); 7,2990 (4,9); 4,8486 (15,7); 4,8403 (16,0); 4,3487 (14,6); 4,3318 (14,5); 2,5835 (4,1); 2,5753 (8,3); 2,5671 (4,1); 2,0438 (1,8); 1,6279 (2,6); 1,2872 (0,8); 0,0332 (5,7)

II.21: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4736 (0,8); 7,2988 (2,6); 4,8793 (16,0); 4,4081 (0,4); 4,3978 (7,5); 4,3798 (7,4); 3,8555 (0,5); 3,8286 (0,5); 1,2882 (0,3); 0,0335 (1,7)

II.22: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5155 (1,8); 7,2702 (2,2); 5,9745 (1,1); 5,9628 (2,1); 5,9536 (1,3); 5,9512 (1,2); 5,9419 (2,4); 5,9285 (2,5); 5,9193 (1,3); 5,9168 (1,3); 5,9076 (2,3); 5,8959 (1,2); 5,3894 (1,8); 5,3866 (3,9); 5,3838 (4,0); 5,3811 (1,7); 5,3550 (1,6); 5,3522 (3,5); 5,3495 (3,5); 5,3467 (1,5); 5,3100 (4,2); 5,3077 (4,1); 5,2891 (3,9); 5,2868 (3,8); 4,7179 (6,0); 4,7155 (9,0); 4,7131 (5,8); 4,7062 (5,7); 4,7038 (8,6); 4,7014 (5,2); 4,2788 (16,0); 4,2688 (15,7); -0,0002 (2,5)

II.23: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5591 (0,9); 7,2984 (13,3); 4,2872 (8,2); 4,2709 (8,2); 3,9517 (16,0); 1,5936 (7,3); 1,2912 (0,4); 0,3334 (0,4); 0,1551 (0,4); 0,1537 (0,4); 0,1521 (0,6); 0,1468 (3,1); 0,1452 (2,0); 0,1358 (91,8); 0,1264 (2,5); 0,1247 (3,2); 0,1193 (0,7); 0,1179 (0,5); 0,1163 (0,4); 0,1149 (0,4); 0,1134 (0,3); 0,0690 (0,4); 0,0471 (0,5); 0,0439 (0,4); 0,0362 (15,4); 0,0285 (0,5); 0,0269 (0,5); 0,0254 (0,6); -0,0648 (0,4)

II.24: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2986 (0,4); 4,1782 (1,9); 4,1625 (1,9); 2,0393 (0,4); 1,5423 (16,0); 0,0299 (0,4)

II.25: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,5555 (1,7); 8,5367 (1,8); 7,3179 (0,8); 7,3152 (1,2); 7,3115 (0,5); 7,2970 (3,8); 7,2947 (3,3); 7,2862 (1,1); 7,2785 (7,6); 7,2714 (7,8); 7,2553 (2,2); 7,2436 (1,4); 7,2394 (1,4); 7,2332 (0,8); 7,2288 (0,9); 7,2223 (2,2); 7,2146 (0,6); 7,2110 (0,5); 7,2056 (0,8); 7,2009 (0,4); 4,6751 (0,7); 4,6615 (1,0); 4,6559 (1,0); 4,6523 (1,2); 4,6424 (1,1); 4,6387 (1,1); 4,6333 (1,1); 4,6196 (0,8); 4,1502 (1,6); 4,1429 (0,3); 4,1327 (5,2); 4,1152 (5,5); 4,0975 (1,9); 3,3267 (21,0); 3,2077 (1,0); 3,1941 (1,0); 3,1732 (2,0); 3,1597 (1,8); 3,1181 (2,0); 3,0950 (2,0); 3,0838 (1,1); 3,0606 (1,0); 2,8912 (0,6); 2,7324 (0,6); 2,5255 (0,4); 2,5120 (10,2); 2,5076 (20,6); 2,5031 (27,0); 2,4985 (19,3); 2,4941 (9,2); 1,2382 (0,5); 1,1855 (7,7); 1,1678 (16,0); 1,1500 (7,4); 0,0080 (0,5); -0,0002 (13,7); -0,0084 (0,5)

II.26: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,5551 (1,7); 8,5364 (1,7); 7,3178 (0,8); 7,3152 (1,2); 7,3115 (0,6); 7,2969 (3,9); 7,2946 (3,4); 7,2861 (1,2); 7,2783 (7,6); 7,2712 (8,0); 7,2551 (2,3); 7,2436 (1,4); 7,2395 (1,4); 7,2332 (0,9); 7,2287 (0,9); 7,2223 (2,2); 7,2147 (0,6); 7,2111 (0,5); 7,2056 (0,8); 7,2011 (0,4); 4,6747 (0,7); 4,6610 (0,9); 4,6556 (1,0); 4,6520 (1,2); 4,6420 (1,0); 4,6383 (1,0); 4,6331 (1,0); 4,6194 (0,7); 4,1500 (1,7); 4,1428 (0,4); 4,1325 (5,3); 4,1150 (5,5); 4,1051 (0,4); 4,0973 (1,9); 3,3270 (32,9); 3,2074 (1,0); 3,1938 (1,0); 3,1730 (2,0); 3,1594 (1,9); 3,1179 (2,0); 3,0948 (2,0); 3,0835 (1,1); 3,0604 (1,0); 2,8914 (0,4); 2,7323 (0,4); 2,5254 (0,5); 2,5120 (11,4); 2,5076 (23,2); 2,5031 (30,6); 2,4985 (22,3); 2,4942 (11,0); 1,2385 (0,5); 1,1855 (7,7); 1,1678 (16,0); 1,1500 (7,4); 0,0079 (0,5); -0,0002 (14,6); -0,0085 (0,6)

II.27: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6591 (1,7); 8,6400 (1,7); 4,4383 (0,7); 4,4267 (0,9); 4,4191 (0,8); 4,4133 (1,0); 4,4077 (1,0); 4,4011 (0,9); 4,3942 (0,8); 4,3821 (0,8); 4,1660 (0,5); 4,1568 (1,0); 4,1476 (1,4); 4,1390 (3,1); 4,1296 (3,4); 4,1212 (3,4); 4,1119 (3,2); 4,1031 (1,5); 4,0942 (1,0); 4,0849 (0,6); 3,3257 (31,0); 2,5259 (0,5); 2,5210 (0,8); 2,5124 (10,9); 2,5080 (21,9); 2,5034 (28,5); 2,4988 (20,2); 2,4943 (9,6); 1,7964 (0,5); 1,7845 (0,8); 1,7707 (0,6); 1,7640 (0,8); 1,7587 (1,0); 1,7524 (1,1); 1,7385 (0,6); 1,7270 (1,1); 1,7070 (0,7); 1,7025 (0,6); 1,6902 (0,8); 1,6861 (0,8); 1,6735 (0,8); 1,6700 (0,6); 1,6577 (0,5); 1,6245 (1,2); 1,6121 (1,0); 1,6029 (0,7); 1,5918 (1,4); 1,5804 (0,8); 1,5707 (0,6); 1,5596 (0,4); 1,2387 (1,1); 1,2147 (7,6); 1,1970 (16,0); 1,1792 (7,4); 0,9283 (9,9); 0,9123 (9,5); 0,8951 (9,3); 0,8792 (9,4); 0,8530 (0,3); 0,0080 (0,5); -0,0002 (15,0); -0,0085 (0,5)

II.28: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6568 (1,6); 8,6377 (1,6); 4,4395 (0,7); 4,4279 (0,9); 4,4203 (0,8); 4,4145 (1,0); 4,4088 (1,1); 4,4023 (0,9); 4,3954 (0,8); 4,3831 (0,8); 4,1667 (0,6); 4,1575 (1,0); 4,1483 (1,5); 4,1397 (3,2); 4,1303 (3,4); 4,1218 (3,4); 4,1126 (3,2); 4,1038 (1,5); 4,0949 (1,0); 4,0856 (0,6); 3,3256 (21,7); 2,5264 (0,4); 2,5216 (0,7); 2,5130 (8,3); 2,5085 (16,7); 2,5040 (21,9); 2,4994 (15,6); 2,4949 (7,4); 1,7971 (0,5); 1,7853 (0,8); 1,7714 (0,6); 1,7648 (0,8); 1,7595 (1,0); 1,7532 (1,1); 1,7394 (0,6); 1,7279 (1,1); 1,7078 (0,7); 1,7035 (0,6); 1,6911 (0,8); 1,6870 (0,8); 1,6746 (0,8); 1,6709 (0,6); 1,6585 (0,5); 1,6253 (1,2); 1,6128 (1,0); 1,6037 (0,7); 1,5926 (1,4); 1,5812 (0,8); 1,5715 (0,6); 1,5603 (0,4); 1,2382 (1,0); 1,2155 (7,8); 1,1978 (16,0); 1,1800 (7,4); 0,9288 (10,0); 0,9128 (9,5); 0,8957 (9,4); 0,8798 (9,4); 0,8529 (0,3); 0,0080 (0,4); -0,0002 (11,8); -0,0085 (0,4)

II.29: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4224 (1,0); 7,2991 (0,5); 3,7387 (16,0); 1,7312 (1,4); 1,7144 (3,1); 1,7035 (3,2); 1,6881 (1,4); 1,3670 (1,4); 1,3514 (3,2); 1,3407 (3,2); 1,3237 (1,1); 0,0225 (0,7)

II.30: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,1199$ (2,3); $8,0990$ (2,3); $7,9549$ (0,9); $4,5040$ (2,5); $4,4930$ (2,6); $4,4830$ (2,6); $4,4720$ (2,5); $2,8939$ (6,6); $2,7351$ (5,4); $2,7339$ (5,4); $2,5487$ (2,3); $2,5277$ (0,5); $2,5229$ (0,8); $2,5143$ (11,6); $2,5098$ (24,0); $2,5053$ (31,7); $2,5007$ (22,7); $2,4961$ (10,8); $2,0302$ (0,6); $2,0185$ (0,7); $2,0129$ (1,2); $2,0013$ (1,3); $1,9954$ (1,4); $1,9839$ (1,3); $1,9781$ (0,8); $1,9667$ (0,7); $1,4409$ (0,8); $1,4237$ (1,3); $1,4063$ (1,9); $1,3887$ (1,8); $1,3714$ (1,2); $1,3533$ (0,4); $1,2692$ (0,4); $1,2656$ (0,5); $1,2467$ (1,4); $1,2383$ (0,9); $1,2282$ (2,2); $1,2099$ (1,6); $1,1938$ (1,5); $1,1754$ (1,0); $0,9615$ (0,5); $0,9444$ (0,7); $0,9267$ (15,5); $0,9162$ (9,2); $0,9095$ (15,8); $0,8979$ (16,0); $0,8794$ (6,4); $0,8532$ (0,5); $0,8359$ (0,3); $0,0080$ (0,6); $-0,0002$ (20,8); $-0,0085$ (0,8)

II.31: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,4776$ (3,5); $8,4582$ (3,3); $7,9558$ (0,6); $4,4027$ (1,3); $4,3918$ (1,9); $4,3783$ (2,0); $4,3724$ (2,2); $4,3478$ (1,2); $2,8941$ (3,3); $2,7349$ (3,2); $2,5503$ (1,6); $2,5092$ (36,0); $2,5056$ (38,6); $1,7820$ (0,9); $1,7708$ (1,3); $1,7442$ (2,5); $1,7409$ (2,5); $1,7157$ (2,6); $1,6949$ (2,0); $1,6788$ (1,8); $1,6638$ (1,4); $1,6425$ (2,4); $1,6301$ (1,7); $1,6222$ (1,6); $1,6115$ (2,4); $1,6004$ (1,4); $1,5909$ (1,0); $1,5817$ (0,6); $1,2397$ (0,9); $0,9257$ (16,0); $0,9103$ (15,9); $0,8956$ (15,6); $0,8802$ (14,1); $0,8551$ (0,8); $0,0011$ (14,0); $-0,0002$ (15,2)

II.32: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,3405$ (2,5); $8,3213$ (2,6); $7,9541$ (0,8); $7,3064$ (1,6); $7,3027$ (0,8); $7,2916$ (2,6); $7,2880$ (5,5); $7,2860$ (5,0); $7,2708$ (16,0); $7,2654$ (12,2); $7,2531$ (2,3); $7,2496$ (3,1); $7,2324$ (2,0); $7,2279$ (2,0); $7,2209$ (1,3); $7,2177$ (1,5); $7,2109$ (3,0); $7,2030$ (1,0); $7,2007$ (1,0); $7,1946$ (1,2); $7,1896$ (0,7); $4,6455$ (1,0); $4,6337$ (1,3); $4,6230$ (1,8); $4,6140$ (1,7); $4,6115$ (1,6); $4,6035$ (1,4); $4,5916$ (1,1); $3,2373$ (1,6); $3,2254$ (1,8); $3,2027$ (2,7); $3,1909$ (2,4); $3,1094$ (2,5); $3,0865$ (2,5); $3,0750$ (1,7); $3,0521$ (1,6); $2,8916$ (6,1); $2,7340$ (5,0); $2,7330$ (5,1); $2,5499$ (1,4); $2,5416$ (0,4); $2,5268$ (0,6); $2,5135$ (12,5); $2,5090$ (25,2); $2,5045$ (32,8); $2,4999$ (23,5); $2,4954$ (11,2); $2,0523$ (0,4); $1,2510$ (0,4); $1,2374$ (0,9); $0,0079$ (0,8); $-0,0002$ (20,3); $-0,0085$ (0,7)

II.33: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 12,8679$ (3,8); $8,5539$ (15,3); $8,5302$ (15,5); $7,9706$ (0,7); $3,8137$ (13,3); $3,7898$ (15,1); $3,7843$ (16,0); $3,7603$ (13,6); $3,6989$ (0,6); $3,3653$ (2,7); $3,1866$ (2,6); $2,9091$ (5,1); $2,7488$ (4,2); $2,5339$ (6,2); $2,5280$ (13,7); $2,5220$ (19,2); $2,5160$ (14,1); $2,5101$ (6,7); $1,3266$ (1,3); $1,3103$ (3,2); $1,2987$ (4,2); $1,2830$ (7,4); $1,2679$ (6,5); $1,2547$ (8,0); $1,2387$ (4,8); $1,2275$ (3,8); $1,2111$ (1,9); $0,6798$ (0,5); $0,6511$ (3,5); $0,6448$ (3,5); $0,6339$ (6,0); $0,6233$ (5,3); $0,6161$ (7,7); $0,6058$ (10,2); $0,5881$ (5,2); $0,5836$ (4,2); $0,5773$ (5,0); $0,5652$ (4,1); $0,5539$ (5,0); $0,5486$ (6,0); $0,5364$ (8,9); $0,5277$ (5,0); $0,5204$ (8,9); $0,5157$ (10,0); $0,5098$ (13,1); $0,4935$ (10,9); $0,4877$ (14,0); $0,4744$ (8,8); $0,4704$ (10,3); $0,4588$ (9,0); $0,4424$ (4,2); $0,4237$ (6,1); $0,4127$ (5,9); $0,4083$ (6,4); $0,3967$ (10,7); $0,3792$ (7,8); $0,3611$ (3,9); $0,3365$ (0,8); $0,0263$ (0,4); $0,0155$ (13,4); $0,0046$ (0,5)

II.34: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7678 (2,1); 8,7510 (2,1); 4,1866 (0,9); 4,1773 (1,0); 4,1688 (1,0); 4,1593 (3,7); 4,1512 (0,6); 4,1413 (5,6); 4,1315 (0,6); 4,1233 (3,8); 4,1139 (1,0); 4,1054 (1,0); 4,0961 (0,9); 3,7652 (2,0); 3,7480 (2,1); 3,7423 (2,2); 3,7251 (2,0); 3,3320 (104,7); 2,5067 (14,8); 2,5023 (19,6); 2,4979 (14,3); 1,2789 (0,6); 1,2677 (0,8); 1,2583 (1,4); 1,2471 (1,4); 1,2359 (1,6); 1,2233 (8,4); 1,2055 (16,0); 1,1878 (7,4); 0,6429 (0,4); 0,6334 (0,5); 0,6299 (0,6); 0,6214 (1,1); 0,6127 (1,2); 0,6080 (1,2); 0,5981 (1,3); 0,5869 (0,8); 0,5770 (0,7); 0,5604 (0,7); 0,5470 (1,0); 0,5379 (1,2); 0,5270 (1,2); 0,5171 (1,4); 0,5049 (0,6); 0,4961 (1,2); 0,4827 (1,0); 0,4735 (1,4); 0,4611 (1,7); 0,4500 (1,3); 0,4375 (0,6); 0,4100 (0,8); 0,3982 (1,2); 0,3867 (1,4); 0,3743 (1,3); 0,3646 (0,8); 0,3524 (0,3); 0,0078 (0,6); -0,0002 (12,2)

II.35: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2986 (1,0); 4,2923 (1,4); 4,2686 (4,1); 4,2447 (4,7); 4,2211 (2,5); 3,1655 (16,0); 2,0305 (2,0); 1,7399 (0,5); 1,3459 (4,6); 1,3221 (9,1); 1,2983 (4,5); 0,0193 (0,8)

II.36: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,0925 (2,4); 5,7253 (0,5); 5,6998 (0,7); 5,6823 (0,7); 5,6775 (0,7); 5,6597 (0,8); 5,6570 (0,9); 5,6344 (0,7); 5,3539 (1,3); 5,3499 (1,4); 5,3112 (1,0); 5,3069 (1,1); 5,1553 (1,4); 5,1508 (1,3); 5,1296 (1,2); 5,1251 (1,2); 3,6272 (16,0); 3,3613 (37,5); 3,3534 (49,9); 2,5285 (0,4); 2,5148 (7,3); 2,5107 (14,5); 2,5063 (18,8); 2,5019 (14,0); 2,3765 (0,4); 2,3544 (1,2); 2,3326 (1,3); 2,3104 (0,5); 1,7474 (1,1); 1,7340 (1,3); 1,7273 (1,2); 1,7139 (1,2); 1,4966 (1,2); 1,4832 (1,2); 1,4728 (1,2); 1,4596 (1,0); -0,0002 (0,4)

II.37: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,5560 (1,7); 8,5371 (1,8); 7,3181 (0,7); 7,3153 (1,2); 7,3115 (0,5); 7,3003 (1,9); 7,2971 (3,7); 7,2946 (3,2); 7,2865 (1,0); 7,2785 (7,1); 7,2713 (7,4); 7,2552 (2,2); 7,2505 (1,0); 7,2438 (1,4); 7,2396 (1,4); 7,2332 (0,8); 7,2289 (0,9); 7,2223 (2,2); 7,2147 (0,5); 7,2109 (0,5); 7,2057 (0,8); 7,2010 (0,4); 4,6747 (0,7); 4,6610 (0,9); 4,6555 (0,9); 4,6519 (1,1); 4,6420 (1,0); 4,6384 (1,0); 4,6329 (1,0); 4,6192 (0,7); 4,1499 (1,6); 4,1322 (4,9); 4,1151 (5,1); 4,0973 (1,8); 3,3264 (26,3); 3,2073 (0,9); 3,1938 (1,0); 3,1730 (1,9); 3,1595 (1,7); 3,1178 (1,8); 3,0947 (1,8); 3,0834 (1,0); 3,0603 (0,9); 2,8912 (0,9); 2,7330 (0,7); 2,7320 (0,7); 2,5254 (0,5); 2,5207 (0,8); 2,5120 (10,9); 2,5076 (22,3); 2,5030 (29,4); 2,4984 (21,1); 2,4939 (10,0); 1,2383 (0,6); 1,1854 (7,6); 1,1676 (16,0); 1,1498 (7,3); 0,0080 (0,6); -0,0002 (15,9); -0,0085 (0,5)

XVIa.01: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,5905 (1,3); 8,5766 (2,4); 8,5627 (1,3); 8,0808 (11,2); 4,1587 (2,5); 4,1409 (7,5); 4,1232 (7,6); 4,1054 (2,6); 4,0334 (8,7); 4,0188 (8,7); 3,3611 (31,7); 3,3532 (84,8); 3,3511 (80,8); 2,8943 (0,4); 2,7353 (0,4); 2,5101 (24,1); 2,5060 (30,3); 2,5019 (23,8); 1,2596 (0,3); 1,2306 (8,4); 1,2128 (16,0); 1,1950 (7,8); -0,0002 (0,4)

XVIa.02: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,5114 (2,4); 8,4927 (2,4); 8,0322 (9,2); 7,9527 (0,4); 7,3139 (1,2); 7,2949 (5,0); 7,2783 (15,4); 7,2606 (3,1); 7,2431 (2,0); 7,2384 (2,0); 7,2292 (1,8); 7,2219 (2,5); 7,2133 (1,2); 7,2060 (1,0); 4,6722 (1,0); 4,6582 (1,4); 4,6499 (1,8); 4,6391 (1,7); 4,6364 (1,7); 4,6309 (1,6); 4,6170 (1,1); 4,1493 (2,0); 4,1319 (6,1); 4,1143 (6,4); 4,0967 (2,3); 3,3611 (133,1); 3,2025 (1,1); 3,1889 (1,3); 3,1681 (2,6); 3,1545 (2,5); 3,1222 (2,6); 3,0993 (2,5); 3,0879 (1,4); 3,0648 (1,2); 2,8937 (2,2); 2,7358 (2,0); 2,5102 (30,4); 2,5062 (37,7); 1,2599 (0,4); 1,2389 (1,5); 1,1881 (7,9); 1,1703 (16,0); 1,1526 (7,7); -0,0002 (0,6)

XVIa.03: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4800 (10,7); 7,4607 (1,7); 7,2990 (20,9); 4,2466 (2,4); 4,2229 (7,4); 4,1991 (7,5); 4,1754 (2,5); 1,7396 (2,1); 1,7228 (6,0); 1,7120 (6,1); 1,6967 (2,7); 1,6435 (0,4); 1,5945 (4,6); 1,3841 (2,8); 1,3688 (6,2); 1,3580 (6,1); 1,3412 (2,3); 1,2987 (8,4); 1,2749 (16,0); 1,2512 (7,7); 0,0477 (1,1); 0,0370 (26,5); 0,0261 (1,0)

XVIb.01: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 7,3701 (2,1); 4,1442 (0,4); 4,1324 (1,3); 4,1205 (1,3); 4,1087 (0,4); 3,9635 (1,4); 3,9537 (1,4); 3,3515 (3,3); 3,3467 (10,2); 3,3448 (16,0); 2,5148 (1,2); 2,5119 (2,6); 2,5088 (3,6); 2,5058 (2,6); 2,5028 (1,2); 1,2244 (1,5); 1,2125 (3,1); 1,2007 (1,4)

XVIb.02: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7305 (0,8); 8,7177 (0,8); 7,3044 (0,5); 7,2915 (1,9); 7,2797 (4,0); 7,2758 (3,2); 7,2652 (0,8); 7,2607 (4,4); 7,2297 (0,4); 7,2266 (0,6); 7,2153 (0,8); 7,2042 (0,3); 4,5937 (0,4); 4,5843 (0,4); 4,5809 (0,4); 4,5775 (0,5); 4,5715 (0,4); 4,5681 (0,4); 4,5647 (0,4); 4,5553 (0,4); 4,1073 (0,6); 4,0954 (1,9); 4,0836 (2,0); 4,0717 (0,7); 3,3321 (4,6); 3,3263 (15,2); 3,3250 (16,0); 3,3247 (16,0); 3,1399 (0,5); 3,1306 (0,5); 3,1169 (0,8); 3,1076 (0,7); 3,0345 (0,8); 3,0181 (0,8); 3,0115 (0,5); 2,9951 (0,5); 2,5079 (3,2); 2,5050 (6,7); 2,5021 (9,1); 2,4991 (6,4); 2,4962 (2,9); 1,2392 (0,3); 1,1501 (2,9); 1,1382 (6,1); 1,1264 (2,9)

XVIb.03: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,9132 (1,4); 8,3126 (2,4); 7,3320 (4,3); 4,0805 (1,0); 4,0687 (3,2); 4,0569 (3,2); 4,0450 (1,0); 3,3322 (5,3); 3,3237 (16,0); 3,3000 (0,9); 2,5083 (2,8); 2,5054 (6,1); 2,5023 (8,6); 2,4993 (6,4); 2,4964 (3,1); 1,4308 (0,9); 1,4230 (2,4); 1,4175 (2,7); 1,4101 (1,0); 1,1667 (3,4); 1,1549 (7,0); 1,1431 (3,3); 1,1303 (1,0); 1,1229 (2,4); 1,1174 (2,4); 1,1095 (0,9)

XVIc.01: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,3043 (2,1); 7,8355 (6,1); 3,6265 (16,0); 3,3513 (2,6); 2,5338 (0,5); 2,5280 (1,1); 2,5220 (1,4); 2,5160 (1,0); 2,5102 (0,5); 1,5032 (1,1); 1,4868 (2,8); 1,4758 (3,0); 1,4614 (1,3); 1,2090 (1,4); 1,1945 (3,0); 1,1835 (2,8); 1,1671 (1,0); 0,0164 (0,9)

XVIc.02: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,4344 (2,4); 7,9531 (0,5); 7,8277 (6,2); 5,7160 (0,5); 5,6907 (0,7); 5,6731 (0,7); 5,6679 (0,7); 5,6502 (0,8); 5,6478 (0,9); 5,6249 (0,7); 5,3627 (1,3); 5,3586 (1,4); 5,3199 (1,0); 5,3157 (1,1); 5,1644 (1,4); 5,1599 (1,3); 5,1387 (1,2); 5,1342 (1,2); 3,6188 (16,0); 3,3472 (21,9); 3,3420 (29,0); 2,8947 (3,7); 2,7358 (3,2); 2,5279 (0,4); 2,5145 (6,8); 2,5102 (13,7); 2,5058 (18,0); 2,5013 (13,4); 2,4971 (7,0); 2,3289 (0,5); 2,3066 (1,1); 2,2853 (1,2); 2,2629 (0,5); 1,7569 (1,1); 1,7437 (1,2); 1,7371 (1,2); 1,7238 (1,1); 1,4771 (1,2); 1,4639 (1,2); 1,4534 (1,2); 1,4402 (1,0); 1,2398 (0,5); -0,0002 (0,3)

XVIc.03: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,2095 (1,0); 9,1929 (1,0); 8,0335 (6,6); 3,7135 (1,1); 3,6968 (1,1); 3,6897 (1,3); 3,6825 (0,5); 3,6728 (1,4); 3,6640 (16,0); 3,3333 (28,8); 2,8928 (0,7); 2,7340 (0,6); 2,7328 (0,5); 2,5218 (0,3); 2,5132 (4,8); 2,5087 (9,7); 2,5041 (12,8); 2,4995 (9,2); 2,4950 (4,4); 1,2167 (0,3); 1,2131 (0,4); 1,2048 (0,6); 1,2014 (0,5); 1,1929 (0,7); 1,1811 (0,6); 1,1732 (0,4); 1,1692 (0,4); 1,1609 (0,3); 0,6365 (0,5); 0,6265 (0,6); 0,6237 (0,6); 0,6154 (0,6); 0,6132 (0,6); 0,6062 (0,4); 0,6018 (0,4); 0,5916 (0,5); 0,5795 (0,4); 0,5762 (0,5); 0,5662 (0,6); 0,5564 (0,6); 0,5461 (0,6); 0,4799 (0,5); 0,4682 (0,7); 0,4560 (0,9); 0,4455 (0,7); 0,3902 (0,4); 0,3782 (0,6); 0,3673 (0,8); 0,3552 (0,7); 0,3428 (0,4)

XVIc.04: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3126 (10,3); 7,2989 (6,2); 6,7720 (1,8); 5,3370 (0,8); 4,2375 (2,4); 4,2137 (7,4); 4,1899 (7,5); 4,1662 (2,4); 1,7013 (1,9); 1,6845 (5,2); 1,6738 (5,4); 1,6584 (2,3); 1,6307 (5,4); 1,3234 (2,6); 1,3080 (5,9); 1,2938 (10,0); 1,2805 (2,6); 1,2700 (16,0); 1,2462 (7,6); 0,0350 (7,0)

XVIc.05: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,0979 (3,5); 9,0743 (3,6); 8,0601 (16,0); 3,6943 (2,8); 3,6707 (3,0); 3,6633 (3,2); 3,6397 (2,8); 2,5334 (0,8); 2,5278 (1,8); 2,5218 (2,5); 2,5159 (1,8); 2,0931 (0,9); 1,2461 (0,7); 1,2313 (0,9); 1,2187 (1,5); 1,2039 (1,5); 1,1887 (1,5); 1,1733 (0,9); 1,1618 (0,8); 1,1457 (0,4); 0,6745 (0,5); 0,6651 (0,6); 0,6594 (0,7); 0,6477 (1,4); 0,6394 (1,3); 0,6307 (1,6); 0,6187 (2,0); 0,6025 (1,0); 0,5905 (1,3); 0,5855 (1,1); 0,5676 (1,3); 0,5551 (1,8); 0,5404 (1,6); 0,5287 (2,3); 0,5188 (1,3); 0,5055 (1,8); 0,5005 (1,7); 0,4921 (2,0); 0,4753 (2,3); 0,4621 (1,7); 0,4456 (0,7); 0,3967 (0,9); 0,3811 (1,6); 0,3672 (2,0); 0,3507 (1,9); 0,3388 (1,1); 0,0114 (1,3)

XVIc.06: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 12,6058 (0,4); 9,2124 (7,5); 7,8263 (16,0); 3,3584 (1,5); 2,5282 (4,5); 2,5223 (6,0); 2,5164 (4,5); 2,0945 (0,8); 1,4547 (2,9); 1,4388 (7,3); 1,4281 (8,1); 1,4141 (3,6); 1,3612 (0,3); 1,1423 (3,6); 1,1282 (7,8); 1,1174 (7,5); 1,1015 (2,8); 0,0173 (2,2)

XVIIc.01: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2985 (0,9); 6,2968 (2,9); 5,8790 (3,7); 4,2235 (2,2); 4,1997 (6,7); 4,1760 (6,8); 4,1523 (2,2); 2,0305 (0,4); 1,6536 (1,9); 1,6373 (5,4); 1,6265 (5,6); 1,6115 (2,3); 1,2774 (7,2); 1,2538 (16,0); 1,2401 (6,2); 1,2298 (12,0); 1,2129 (2,1); 0,0202 (0,8)

XVIIIc.01: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3430 (0,4); 7,2989 (4,6); 6,7348 (0,4); 4,2303 (0,5); 4,2066 (1,5); 4,1828 (1,6); 4,1591 (0,5); 1,6856 (0,4); 1,6690 (1,2); 1,6582 (1,2); 1,6430 (0,6); 1,6095 (2,7); 1,5410 (16,0); 1,2930 (2,2); 1,2790 (1,3); 1,2691 (4,4); 1,2514 (0,6); 1,2454 (1,6); 0,0368 (5,5)

XIXc.01: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $d_6\text{-DMSO}$):

δ = 13,4605 (1,6); 13,3786 (1,6); 13,2747 (2,0); 13,2607 (2,1); 13,2418 (2,4); 13,1976 (2,6); 13,1780 (2,4); 13,1651 (2,6); 13,0998 (2,9); 13,0936 (2,9); 13,0821 (3,0); 13,0381 (3,2); 12,9902 (3,5); 12,9696 (3,4); 12,9563 (3,4); 12,9261 (3,3); 12,9166 (3,1); 12,9040 (3,3); 12,8582 (3,1); 12,8359 (3,4); 12,8242 (3,0); 12,7876 (2,7); 12,6640 (2,0); 12,5368 (1,6); 12,5068 (1,6); 12,4811 (1,6); 7,1025 (1,6); 7,0457 (2,2); 7,0074 (2,0); 6,9258 (3,4); 6,8352 (5,3); 6,6472 (16,0); 6,5167 (6,9); 6,4124 (2,9); 6,3341 (1,8); 6,1823 (1,6); 3,9925 (1,7); 3,8936 (1,8); 3,7735 (1,8); 3,7667 (1,6); 3,6496 (2,9); 3,3680 (566,0); 3,2044 (4,4); 3,0765 (1,6); 3,0065 (1,9); 2,9799 (1,6); 2,7531 (2,5); 2,5392 (262,9); 2,5339 (326,0); 2,3041 (2,0); 1,2671 (1,7); 0,2259 (1,9); 0,0305 (246,1); -0,0116 (1,7); -1,0984 (1,8)

Dữ liệu sinh học

Ví dụ A: Thử nghiệm tế bào *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* in vitro

Dung môi: DMSO

Môi trường nuôi cấy: Canh trường LB (Luria Broth Miller) Sigma

Chủng cấy: Thể huyền phù vi khuẩn

Các hợp chất cần thử nghiệm được hòa tan trong DMSO và dung dịch được sử dụng để tạo ra khoảng nồng độ mong muốn. Nồng độ cuối của DMSO được sử dụng trong thử nghiệm này là $\leq 1\%$.

Chất chủng được điều chế từ dung dịch nuôi cấy sơ bộ chứa vi khuẩn sinh trưởng trong môi trường lỏng và được pha loãng tới mật độ quang mong muốn (OD).

Các hợp chất được đánh giá về khả năng của chúng trong việc ức chế sự phát triển của vi khuẩn trong thử nghiệm nuôi cấy lỏng. Các hợp chất được bổ sung với nồng độ mong muốn vào môi trường nuôi cấy chứa huyền phù vi khuẩn. Sau 24 giờ ủ, hiệu quả của hợp chất được xác định bằng cách đo phổ tăng trưởng của vi khuẩn. Khả năng ức chế được xác định bằng cách so sánh các giá trị độ hấp thụ trong các giếng chứa các hợp chất với độ hấp thụ của các giếng đối chứng không chứa hợp chất.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện không có hoạt tính trực tiếp ở nồng độ hợp chất thử nghiệm 20 ppm: II.01; II.02; II.03; II.04; II.06; II.07;

II.08; II.09; II.10; II.11; II.12; II.13; II.14; II.15; II.16; II.17; II.18; II.19; II.20; II.21; II.22; II.23; II.24; II.35; II.36.

Ví dụ B: Thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* (bệnh thối đen ở cải bắp)

Các hợp chất thử nghiệm được điều chế bằng cách đồng nhất hóa trong hỗn hợp axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®, và sau đó được pha loãng với nước để thu được nồng độ mong muốn.

Các cây cải bắp non được xử lý bằng cách phun hợp chất được điều chế như được mô tả ở trên. Các cây đối chứng chỉ được xử lý bằng dung dịch nước chứa axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, các cây được gây nhiễm bằng cách phun lên lá dung dịch huyền phù nước chứa vi khuẩn *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*. Các cây cải bắp đã gây nhiễm được ủ trong thời gian từ 8 đến 10 ngày ở nhiệt độ 27°C ở độ ẩm tương đối 95%.

Thử nghiệm được đánh giá 8 đến 10 ngày sau khi ủ. 0% nghĩa là hiệu lực tương ứng với hiệu lực của cây đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh xuất hiện.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ hoạt chất thử nghiệm là 31 ppm: II.02; II.31; II.35.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ hoạt chất thử nghiệm là 31 ppm: II.03; II.04; II.15.

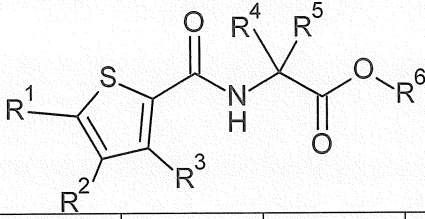
Trong thử nghiệm này, các hợp chất theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ hoạt chất thử nghiệm là 31 ppm: II.01; II.06; II.14; II.36.

Ví dụ C: Các ví dụ so sánh

Các hợp chất CMP1 và CMP2 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* (bệnh thối đen ở cải bắp) trong các điều kiện tương tự như được mô tả trong Ví dụ B.

Các hợp chất CMP1 và CMP2 được điều chế theo hướng dẫn của US 5,534,541.

Các kết quả được nêu trong Bảng dưới đây.

							
Ví dụ	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Hiệu lực (%)
CMP1	Br	Br	Br	H	H	Me	27
II.01	Cl	Cl	Cl	H	H	Me	>90
CMP2*	Cl	Cl	Cl	isopropyl	H	Me	0
II.01	Cl	Cl	Cl	H	H	Me	>90
II.06	Cl	Cl	Cl	cyclopropyl	H	Me	>90
II.14	Cl	Cl	Cl	butan-2-yl	H	Me	>90
II.36	Cl	Cl	Cl	-CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-		Me	>90

* (S) Chất đồng phân đối ảnh

Ví dụ D: Cảm ứng sự biểu hiện của gen phòng vệ ở *Arabidopsis thaliana*

Thực vật thông báo *Arabidopsis thaliana* chứa trình tự mã hóa protein huỳnh quang xanh lục (green fluorescent protein - GFP) được liên kết với trình tự khởi đầu đáp ứng salicylat gen PR1 (protein liên quan đến sinh bệnh học I) (AT2G14610) được trồng trong năm ngày và sau đó được phun các hợp chất. Vào ngày thứ ba sau khi phun, mức phát huỳnh quang thực vật được đánh giá bằng thiết bị MacroFluo của Leica Microsystems (Wetzlar, Germany). Mức huỳnh quang được định lượng bằng phần mềm phân tích hình ảnh & tự động hóa kính hiển vi Meta-Morph. (Molecular Devices, Sunnyvale, Calif., United States).

Mức phát huỳnh quang nền trong những lá được xử lý bằng giả được đặt là 1,00. Việc xử lý bằng axit salicylic (300ppm) dẫn đến kết quả là giá trị huỳnh quang tương đối là 2,70, chứng tỏ tính hợp lệ của hệ thống thử nghiệm.

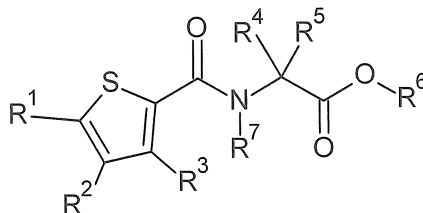
Trong thử nghiệm này, các hợp chất theo sáng chế thể hiện giá trị huỳnh quang tương đối ít nhất là trên 2 ở nồng độ là 300 ppm hợp chất: II.01; II.02; II.03; II.04; II.05; II.07; II.08; II.09; II.10; II.11; II.12; II.13; II.14; II.15; II.17; II.18; II.19; II.20; II.22; II.23; II.24; II.25; II.26; II.30; II.31; II.32; II.33; II.35; II.36; II.37.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất theo sáng chế thể hiện giá trị huỳnh quang tương đối ít nhất là trên 2 ở nồng độ là 75 ppm hợp chất: II.16; II.28.

Salixylat là hormon phòng vệ chính chống lại mầm bệnh thực vật. Tất cả các hợp chất được mô tả ở trên kích thích con đường axit salixylic và do đó có thể bảo vệ thực vật chống lại nhiều loại mầm bệnh.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (II):



(II)

trong đó

R^1 , R^2 và R^3 là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

R^7 là nguyên tử hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl.

2. Hợp chất có công thức (II) theo điểm 1, trong đó R^6 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, xyclopropyl, phenyl, benzyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl.

3. Hợp chất có công thức (II) theo điểm 1 hoặc 2, trong đó R^7 là nguyên tử hydro hoặc metyl.

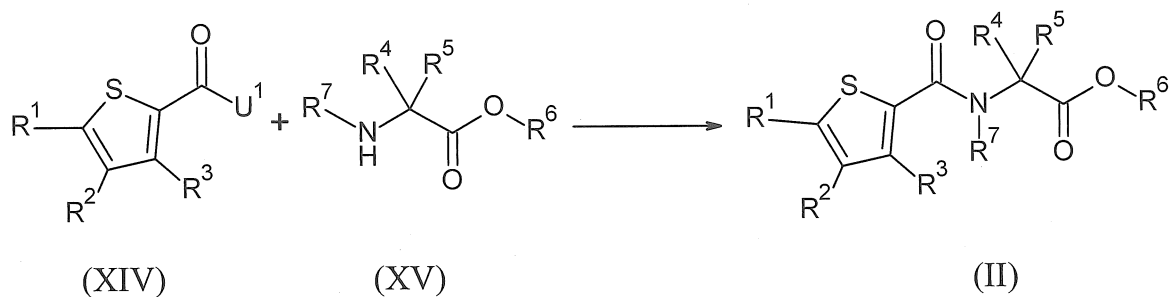
4. Hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó R^4 là nguyên tử hydro hoặc isobutyl.

5. Hợp chất có công thức (II) theo điểm 1, 2 hoặc 3, trong đó R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl.

6. Chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên và ít nhất một chất phụ trợ thích hợp trong nông nghiệp.

7. Phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn bao gồm bước áp dụng ít nhất một hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 hoặc chế phẩm theo điểm 6 lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất nơi thực vật sinh trưởng trên đó.

8. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, bao gồm bước cho hợp chất có công thức (XIV) hoặc muối của nó phản ứng với hợp chất có công thức (XV) hoặc muối của chúng:

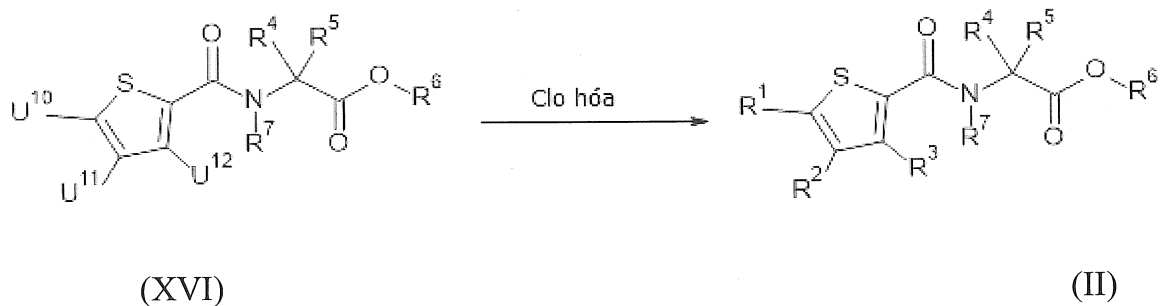


trong đó

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ và R^7 là như được xác định trong các điểm từ 1 đến 5;

U^1 là nguyên tử halogen, nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy.

9. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5 bao gồm bước thực hiện phản ứng clo hóa đối với hợp chất có công thức (XVI)



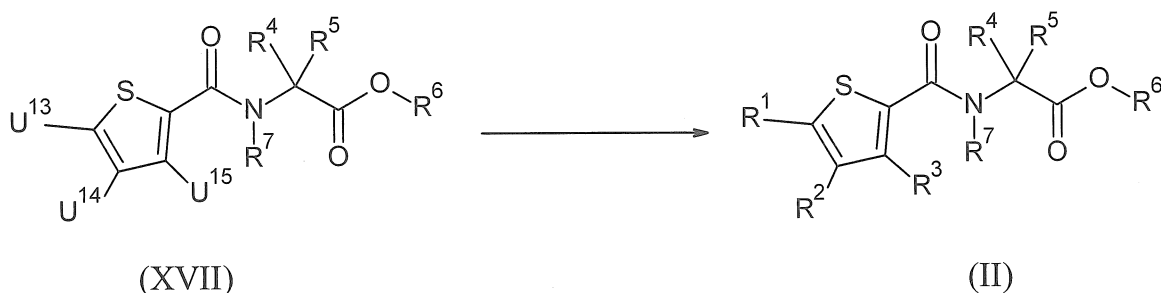
trong đó

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ và R^7 là như được xác định trong các điểm từ 1 đến 5;

U^{10}, U^{11} và U^{12} độc lập là nguyên tử hydro hoặc nguyên tử clo;

miễn là ít nhất một trong số U^{10} , U^{11} hoặc U^{12} là nguyên tử hydro.

10. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (II) theo điểm bất kì trong số các điểm từ 1 đến 5, bao gồm bước thực hiện phản ứng diazo hóa hợp chất có công thức (XVII) hoặc muối của chúng sau đó là phản ứng thế thơm:



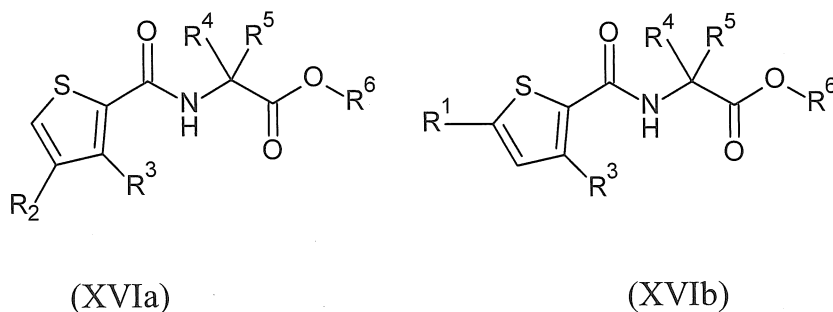
trong đó

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và R^7 là như được xác định trong các điểm từ 1 đến 5;

U^{13} , U^{14} và U^{15} độc lập là nhóm amino hoặc nguyên tử clo;

miễn là ít nhất một trong số U^{13} , U^{14} hoặc U^{15} là nhóm amino.

11. Hợp chất có công thức (XVIa) hoặc (XVIb):



trong đó

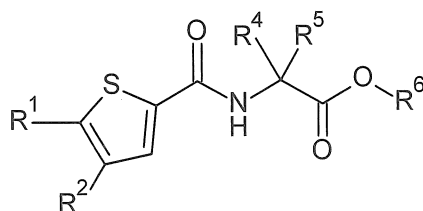
R^1 , R^2 , R^3 là nguyên tử clo;

R^4 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C_2 - C_6 -alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R^5 là nguyên tử hydro; hoặc

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R⁶ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl- C₃-C₈-xycloalkyl.

12. Hợp chất có công thức (XVIc):



(XVIc)

R¹, R² là nguyên tử clo;

R⁴ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C₂-C₆-alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R⁵ là nguyên tử hydro; hoặc

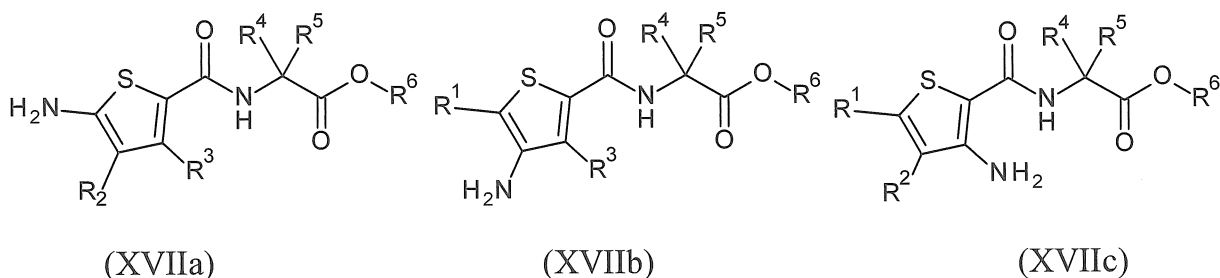
R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R⁶ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl- C₃-C₈-xycloalkyl;

miễn là hợp chất có công thức (XVIc) không phải là :

- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin [138326-45-1],
- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxin [138326-47-3],
- N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxin [138326-54-2],
- metyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxinat [138326-32-6],
- metyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxinat [138326-33-7],
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]valinat [138326-35-9],
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]leuxinat [138326-36-0], và
- 2,2,2-trifloetyl N-[(4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]isoleuxinat [138326-37-1].

13. Hợp chất có công thức (XVIIa), (XVIIb) hoặc (XVIIc):



trong đó

R¹, R², R³ là nguyên tử clo;

R⁴ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, 2-metylpropyl, 1-metylpropyl, xyclopropyl, xyclopropyl được thế bằng C₂-C₆-alkenyl, aralkyl và aralkyl được thế bằng hydroxyl và R⁵ là nguyên tử hydro; hoặc

R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng được liên kết vào tạo ra xyclopropyl;

R⁶ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-xycloalkyl;

trong đó R⁴ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, aralkyl, aralkyl được thế bằng hydroxyl, C₁-C₆-alkyl được thế bằng C₁-C₆-alkylsulfanyl và R⁵ là nguyên tử hydro khi R⁶ là nguyên tử hydro hoặc C₁-C₆-alkyl.