



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

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ



1-0044695

(51)^{2020.01} C07D 333/38; A01P 1/00; A01N 43/10; (13) B
A01N 53/00

(21) 1-2022-00030

(22) 30/06/2020

(86) PCT/EP2020/068324 30/06/2020

(87) WO2021/001331 07/01/2021

(30) 19184093.3 03/07/2019 EP

(45) 25/04/2025 445

(43) 25/04/2022 409A

(71) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany

(72) DUFOUR, Jeremy (FR); NICOLAS, Lionel (FR); TSUCHIYA, Tomoki (JP);

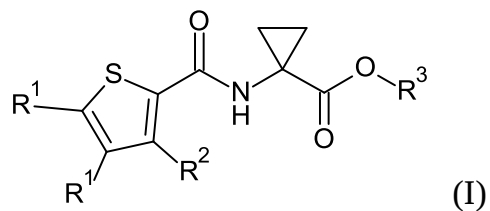
BERNIER, David (FR); KNOBLOCH, Thomas (FR); BRUNET, Stephane (FR).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT THIOPHEN CARBOXAMIT ĐƯỢC THỂ VÀ CÁC DẪN XUẤT CỦA
CHÚNG CÓ TÁC DỤNG DIỆT VI SINH VẬT, QUY TRÌNH ĐIỀU CHẾ HỢP
CHẤT NÀY VÀ CHẾ PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY

(21) 1-2022-00030

(57) Sáng chế đề cập đến dẫn xuất thiophen carboxamid được thể có công thức (I), phương pháp kiểm soát vi sinh vật gây bệnh thực vật sử dụng hợp chất này, quy trình điều chế các hợp chất và các chế phẩm chứa các hợp chất này.



Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất thiophen carboxamit được thế, sử dụng chúng để kiểm soát vi sinh vật gây bệnh thực vật và chế phẩm chứa hợp chất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

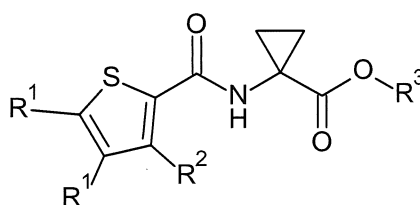
WO2004/024692 bộc lộ rằng một số dẫn xuất axit heteroxyclylcarbonyl aminoxyclopropan carboxylic có thể được sử dụng làm chất diệt vi sinh vật.

Mặc dù nhiều chất diệt vi sinh vật đã được phát triển cho đến nay, vẫn có nhu cầu phát triển các hợp chất diệt vi sinh vật mới để giải quyết các yêu cầu ngày càng tăng về môi trường và kinh tế đối với các chế phẩm và thuốc bảo vệ thực vật ngày nay. Điều này bao gồm, ví dụ, sự cải thiện phổ hoạt động, đặc tính an toàn, tính chọn lọc, tỷ lệ áp dụng, sự hình thành dư lượng, và khả năng điều chế thuận lợi. Cũng có thể mong muốn có các hợp chất mới để ngăn ngừa sự xuất hiện tính kháng thuốc.

Sáng chế cũng đề xuất các hợp chất mới mà có ưu điểm so với các hợp chất và chế phẩm đã biết ở ít nhất một số khía cạnh trong số các khía cạnh này.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

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



(I)

trong đó R^1 , R^2 và R^3 là như được đề cập ở đây cũng như các muối, N-oxit và solvat của chúng.

Sáng chế đề cập đến chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây và ít nhất một chất mang thích hợp trong nông nghiệp.

Sáng chế đề cập đến các quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây và các chất trung gian của chúng.

Sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát vi sinh vật gây bệnh thực vật mà bao gồm bước áp dụng ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây hoặc chế phẩm như được xác định ở đây cho cây, bộ phận của cây, hạt, quả hoặc cho đất mà cây sinh trưởng trên đó.

Mô tả chi tiết sáng chế

Định nghĩa

Thuật ngữ “alkyl” như được sử dụng ở đây trong ngữ cảnh là alkyl hoặc alkylsulfonyl, alkylsulfinyl, alkylthio, alkylamino, ví dụ, được hiểu tốt hơn có nghĩa là alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, có nghĩa là *ví dụ* metyl, etyl, *n*-propyl, *iso*-propyl, *n*-butyl, *iso*-butyl, *tert*-butyl, *sec*-butyl, pentyl, *iso*-pentyl, hexyl, heptyl, octyl, nonyl và detyl và các chất đồng phân tương tự của chúng.

Thuật ngữ “haloalkyl” như được sử dụng ở đây được hiểu tốt hơn có nghĩa là alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như được định nghĩa ở trên, trong đó một hoặc nhiều nhóm thế hydro được thay thế theo cách giống hoặc khác với halogen. Đặc biệt tốt hơn là, haloalkyl này là, *ví dụ* clometyl, flopropyl, flometyl, diflometyl, triclometyl, 2,2,2-trifloetyl, pentaflloetyl, bromobutyl, triflometyl, iodoetyl, và các chất đồng phân của chúng.

Thuật ngữ “xycloalkyl” như được sử dụng ở đây để chỉ vòng chứa cacbon đơn vòng không thơm, có từ 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 “heteroxyclyl” như được sử dụng ở đây để chỉ dị vòng no hoặc chưa no một phần có bốn, năm hoặc sáu cạnh chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ nhóm bao gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh. Nếu vòng này chứa nhiều hơn một nguyên tử oxy, chúng không liên kế trực tiếp với nhau.

Thuật ngữ “halogen” hoặc “Hal” như được sử dụng ở đây được hiểu có nghĩa là flo, clo, brom hoặc iôt.

Thuật ngữ “halo” bên trong dấu ngoặc kép (ví dụ, “C₁-C₆-(halo)alkyl”) để chỉ sự có mặt tùy ý của một hoặc nhiều nhóm thế halogen mà có thể là giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “alkenyl” như được sử dụng ở đây, được hiểu tốt hơn 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-metyl-prop-2-en-1-yl, hoặc 2-metyl-prop-1-en-1-yl.

Thuật ngữ “alkynyl” như được sử dụng ở đây, được hiểu tốt hơn 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 ở đây 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). 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 nhóm thế, thì (các) nhóm thế này có thể ở vị trí bất kỳ trên (các) vòng aryl này. Cụ thể, trong trường hợp aryl là nhóm phenyl, (các) nhóm 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 nhóm thế phức hợp (ví dụ, aryloxy).

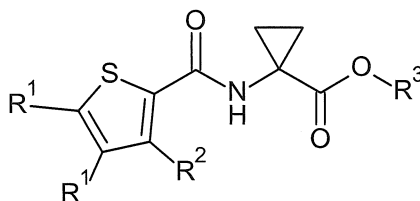
Thuật ngữ “aralkyl” như được sử dụng ở đây để chỉ C₁-C₆-alkyl được thế bằng aryl như được định nghĩa ở đây. Các ví dụ về aralkyl bao gồm nhóm benzyl (-CH₂-C₆H₅).

Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “C₁-C₆”, ví dụ trong ngữ cảnh của định nghĩa về “C₁-C₆-alkyl”, hoặc “C₁-C₆-alkoxy”, được hiểu có nghĩa là nhóm có số nguyên tử cacbon hữu hạn từ 1 đến 6, tức là 1, 2, 3, 4, 5, hoặc 6 nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ “nhóm rời” như được sử dụng ở đây được hiểu có nghĩa là nhóm mà được thay thế từ hợp chất trong phản ứng thế hoặc phản ứng loại bỏ, ví dụ nguyên tử halogen, nhóm triflometansulfonat (“triflat”), alkoxy, metansulfonat, p-toluensulfonat, v.v..

Thành phần hoạt tính

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



trong đó

R¹ là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R² được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R³ 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, heteroaryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl, và nếu cả R¹ và R² đều là nguyên tử brom, thì R³ được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl, và nếu R³ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C₁-C₆-alkyl, thì R₂ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom và nguyên tử iot;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên, R^1 là các nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên khác, R^1 là các nguyên tử brom.

Theo phương án được ưu tiên khác, R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo và nguyên tử brom.

Theo phương án được ưu tiên khác, R^1 là khác với R^2 .

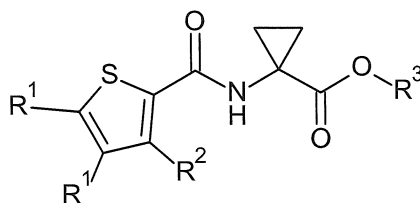
Theo phương án được ưu tiên khác, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom.

Theo phương án khác, R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo và nguyên tử flo.

Theo phương án khác, R^3 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, aralkyl và - C_1 - C_6 -alkyl- xyclopropyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Theo phương án được ưu tiên khác, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom và R^3 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, aralkyl và - C_1 - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xyclopropyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Khía cạnh khác của sáng chế là hợp chất có công thức (I):



trong đó

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

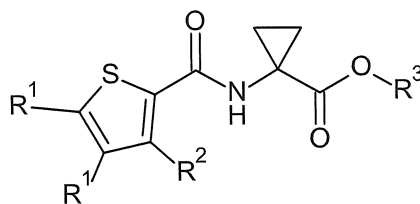
R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl và nếu cả R^1 và R^2 đều là các nguyên tử brom, thì R^3 được chọn từ nhóm bao gồm 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl, và nếu R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl, thì R_2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom và nguyên tử iôt;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom và R^3 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, aralkyl và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để kiểm soát nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên cây hoặc các bộ phận của cây:



(I)

trong đó

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R^3 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl)₃ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo;

trong bảo vệ thực vật.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử brom.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo và nguyên tử brom.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là khác với R^2 .

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo và nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^3 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl)₃ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Theo phương án được ưu tiên khác của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom và R^3 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, aralkyl và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xyclopropyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Theo phương án được ưu tiên khác của khía cạnh này,

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo và nguyên tử flo;

R^3 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl)₃ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên khác của khía cạnh này,

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo và nguyên tử flo;

R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl và aralkyl

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là nguyên tử clo.

Theo phương án được ưu tiên khác của khía cạnh này,

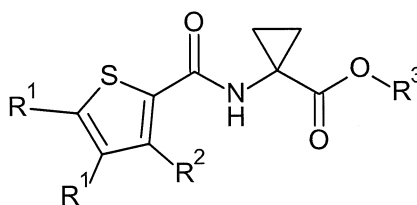
R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo và nguyên tử flo;

R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl và aralkyl

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là nguyên tử clo và với điều kiện là R^2 không phải nguyên tử brom khi R^1 là nguyên tử brom.

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để kiểm soát nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên cây hoặc các bộ phận của cây:



(I)

trong đó

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R^3 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo;

trong bảo vệ thực vật.

Theo phương án được ưu tiên của khía cạnh này, R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom và R^3 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, aralkyl và $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.

Không được bao hàm ở đây là các hợp chất thu được từ các tổ hợp mà 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 nguyên tử oxy liền kề được loại trừ.

Tùy thuộc vào bản chất của nhóm thế, hợp chất có công thức (I) 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 atropi hoặc chất đồng phân hình học. Do đó, sáng chế bao hàm cả các đồng phân lập thể nguyên chất và hỗn hợp bất kỳ của các đồng phân này. Khi một hợp chất có thể xuất hiện trong hai hoặc nhiều dạng chất hỗ biến ở trạng thái cân bằng, việc đề cập đến hợp chất này bằng cách mô tả một chất hỗ biến được cho là bao gồm tất cả các dạng hỗ biến.

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 nhóm thế 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 có, theo mọi tỷ lệ.

Hợp chất có công thức (I) 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 nhóm thế, hợp chất có công thức (I) có thể xuất hiện ở dạng hợp chất tự do và/hoặc muối của nó, như muối có hoạt tính hóa nông.

Muối có 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 axit flohydric, axit clohydric, axit bromhydric và axit hydroiodic, axit sulphuric, axit phosphoric và axit nitric, và muối axit, như natri bisulfat và kali bisulfat. Các axit hữu cơ hữu dụng bao gồm, 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 chưa bão hòa đôi 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 từ 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 nhóm thế khác, ví dụ, axit p-toluensulfonic, axit salixylic, axit p-aminosalixylic, axit 2-phenoxybenzoic, axit 2-axetoxybenzoic, v.v..

Các solvat của hợp chất có công thức (I) hoặc muối của chúng là hỗn hợp hóa học tỷ lệ của hợp chất với các dung môi.

Các hợp chất có công thức (I) 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.

Sáng chế đề cập đến các hợp chất bất kỳ có công thức (I) được bộc lộ trong bảng cũng như việc sử dụng chúng trong bảo vệ thực vật (tức là, để kiểm soát nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên cây hoặc bộ phận của cây và/hoặc kiểm soát tuyến trùng).

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo sáng chế và ít nhất một chất phụ trợ thích hợp trong nông nghiệp.

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát bệnh vi khuẩn và/hoặc nấm và/hoặc kiểm soát tuyến trùng bao gồm bước áp dụng ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế cho cây, bộ phận của cây, hạt, quả hoặc cho đất mà cây trồng sinh trưởng trên đó.

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế để kiểm soát bệnh vi khuẩn và/hoặc nấm và/hoặc kiểm soát tuyến trùng. Tốt hơn là, chúng được sử dụng để kiểm soát bệnh vi khuẩn hoặc nấm.

Tốt hơn là, hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế được sử dụng để chống lại: Các bệnh do mầm bệnh phấn trắng gây ra, như loài *Podosphaera* (ví dụ *Podosphaera leucotricha*), loài *Sphaerotheca* (ví dụ *Sphaerotheca fuliginea*); các bệnh do mầm bệnh rỉ sắt gây ra, như loài *Uromyces* (ví dụ *Uromyces appendiculatus*); bệnh do các mầm bệnh từ nhóm các Oomycete gây ra, như loài *Peronospora* (ví dụ *Peronospora parasitica*), loài *Phytophthora* (ví dụ *Phytophthora infestans*), loài *Plasmopara* (ví dụ *Plasmopara viticola*), loài *Pseudoperonospora* (ví dụ *Pseudoperonospora humuli* hoặc *Pseudoperonospora cubensis*), loài *Pythium* (ví dụ *Pythium ultimum*); bệnh đốm lá và bệnh héo lá gây ra, ví dụ, bởi loài *Alternaria* (ví dụ *Alternaria solani*), loài *Cercospora* (ví dụ *Cercospora beticola*), loài *Colletotrichum* (ví dụ *Colletotrichum lindemuthianum*), loài *Venturia* (ví dụ *Venturia inaequalis*); bệnh do các mầm bệnh vi khuẩn gây ra, ví dụ loài *Xanthomonas* (ví dụ *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*), loài *Pseudomonas* (ví dụ *Pseudomonas syringae* pv. *tomato*), loài *Erwinia* (ví dụ *Erwinia amylovora*), loài *Liberibacter* (ví dụ *Liberibacter Candidatus*), loài *Ralstonia* (ví dụ *Ralstonia solanacearum*).

Theo khía cạnh khác của sáng chế, hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế được sử dụng làm chất hoạt hóa tuyến phòng vệ thực vật. Chất cảm ứng tuyến phòng vệ thực vật theo sáng chế là hợp chất hoặc chế phẩm mà kích thích hệ thống phòng vệ của chính thực vật này.

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

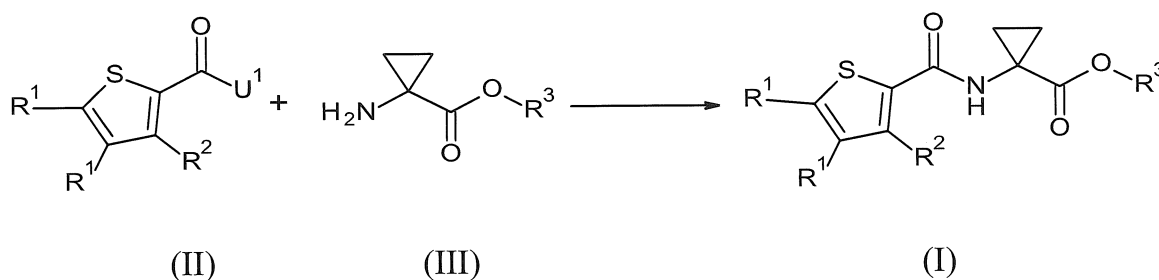
Sáng chế đề cập đến các quy trình điều chế các hợp chất có công thức (I). Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng nhiều con đường khác nhau tương

tự với các quy trình đã biết (xem các tài liệu tham khảo trong đó), và bởi một hoặc nhiều con đường tổng hợp trong số các con đường tổng hợp sau đây và trong phần thực nghiệm.

Trừ khi được chỉ ra là khác, trong phần sau đây, R^1 , R^2 và R^3 có cùng nghĩa như được nêu trên đây cho các hợp chất có công thức (I).

Quy trình 1

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình 1 mà bao gồm bước cho hợp chất có công thức (II) hoặc một trong số các muối của chúng phản ứng với hợp chất có công thức (III) hoặc một trong số các muối của nó như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình 1

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 1 được tiến hành một cách thuận lợi trong sự có mặt của chất ngưng tụ. Các chất 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 cloroformat, metyl cloroformat, isopropyl cloroformat, isobutyl cloroformat hoặc metansulfonyl clorua; carbodiimit, như N,N'-dicyclohexylcarbodiimit (DCC), N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethylcarbodiimit 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 hexaflophosphat (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylamino tetrafloroborat (TBTU), (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminoxy)dimetylamino-morpholino-carbenium

hexaflophosphat, N,N'-carbonyl-diimidazol, 2-etoxy-N-etoxyacacbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/tetraclometan, 4-(4,6-dimetoxy[1,3,5]-triazin-2-yl)-4-metylmorpholin clorua hydrat, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic clorua (BOP-Cl), bromo-tripyrrolidinophosphonihexaflophosphat (PyBroP), 2-clo-1,3-dimetylimidazolini clorua (DMC) hoặc propanphosphonic anhydrit (T3P).

Khi U¹ có mặt trong nguyên tử halogen, quy trình 1 được thực hiện một cách thuận lợi trong sự có mặt của chất gắn kết axit. Các chất gắn kết axit thích hợp để thực hiện quy trình 1 trong mỗi trường hợp là tất cả các bazơ vô cơ và hữu cơ mà thông thường cho các phản ứng như vậy. Ưu tiên các cacbonat kim loại kiềm, như xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, kali bicacbonat, natri bicacbonat, axetat kim loại kiềm thổ, như natri axetat, kali axetat, canxi axetat và amin bậc ba, như trimetylamin, trietylamin, diisopropyletylamin, 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 U¹ là nhóm C₁-C₆-alkoxy, quy trình 1 có thể được thực hiện với lượng dư của thành phần amin, tùy ý trong sự có mặt của axit Lewis như trimetyl nhôm.

Nếu thích hợp, quy trình 1 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 1 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ trơ thông thường với điều kiện 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 hydrocacbon béo, vòng béo hoặc thơm tùy ý được halogen hóa, như ete dầu mỏ, pentan, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin, ISOPAR™ E hoặc ISOPAR™ G clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloroform, cacbon tetraclohua, 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-dimetoxyetan, 1,2-dietoxyetan 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 methyl axetat hoặc ethyl axetat, các sulfoxit, như dimethyl sulfoxit, hoặc các sulfon, như sulfolan; và hỗn hợp của các dung môi này.

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

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

Các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là nhóm hydroxy là có bán sẵn trên thị trường, có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là nhóm C_1 - C_6 -alkoxy bởi các quy trình đã biết rõ như sự thủy phân bazơ hoặc có thể được điều chế bằng nhiều con đường khác nhau tương tự với các quy trình đã biết được mô tả trong tài liệu Beilstein Journal of Organic Chemistry (2007), 3, No. 23; Justus Liebigs Annalen der Chemie (1937), 532, 236-49; WO2017212010; WO2003024961; Journal of Agricultural and Food Chemistry (2007), 55(18), 7517-7526 và các tài liệu tham khảo khác trong đó, hoặc bằng một hoặc nhiều con đường tổng hợp sau đây được mô tả dưới đây (như quy trình 3, quy trình 5 hoặc quy trình 6) và trong phần thực nghiệm.

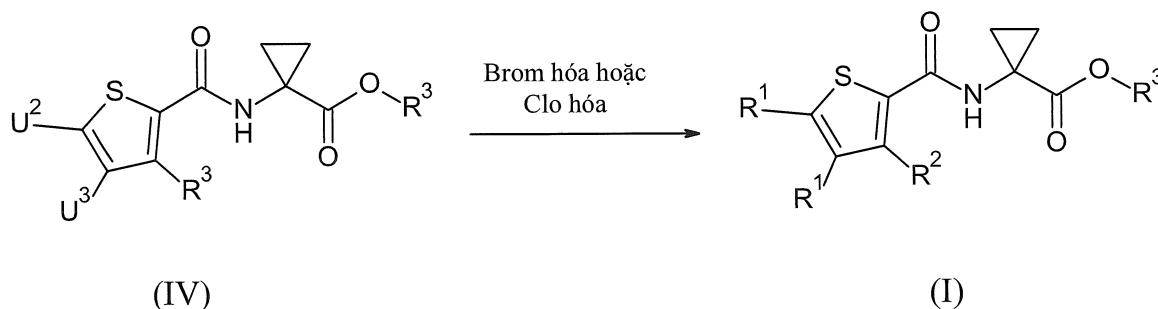
Các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là halogen có bán sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là nhóm hydroxy bằng các quy trình đã được biết rõ.

Các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là nhóm C_1 - C_6 -alkoxy có bán sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (II) trong đó U^1 là nhóm hydroxy bằng các quy trình đã biết rõ hoặc bằng quy trình 3, quy trình 5 hoặc quy trình 6.

Quy trình 2

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình C1 từ hợp chất có công thức (IV) hoặc một trong số các muối của nó bằng cách

thực hiện phản ứng brom hóa hoặc clo hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình 2

trong đó U^2 là nguyên tử hydro, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom và U^3 là nguyên tử hydro, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom với điều kiện là ít nhất một trong số U^2 hoặc U^3 là nguyên tử hydro.

Quy trình 2 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (WO2008109786, WO2007098356).

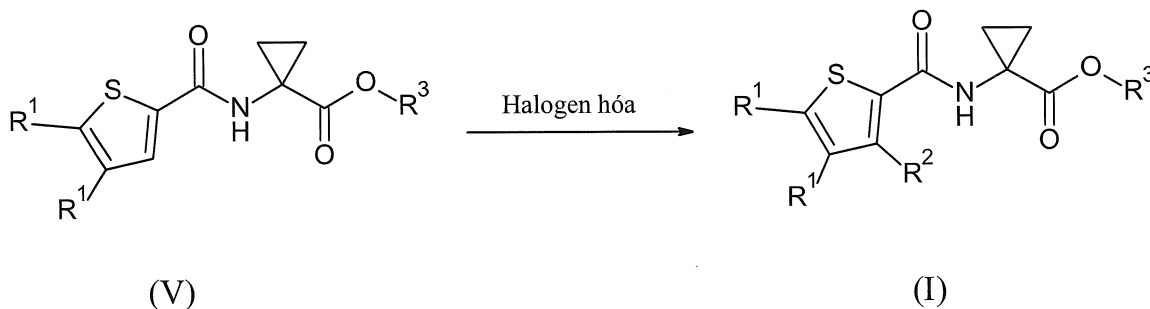
Quy trình 2 được thực hiện với sự có mặt của tác nhân brom hóa hoặc tác nhân clo hóa và nếu thích hợp, với sự có mặt của dung môi.

Các chất brom hóa hoặc clo hóa thích hợp để thực hiện quy trình 2 không bị giới hạn cụ thể với điều kiện là chúng được sử dụng để brom hóa hoặc clo hóa. Ví dụ về các chất brom hóa bao gồm brom, N-bromosuccinimide và 1,3-dibromo-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione. Các ví dụ về các chất clo hóa bao gồm N-closuccinimide, sulfuric chloride và 1,3-dichloro-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình 2 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ thông thường với điều kiện 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 mô tả đối với quy trình 1. Để thực hiện quy trình 2, cũng có lợi khi sử dụng axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit trifluoroacetic làm dung môi hoặc đồng dung môi. Để thực hiện quy trình 2, cũng có thể có lợi khi sử dụng axit Lewis như kẽm chloride (II) làm chất xúc tác.

Quy trình 3

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình 3 từ hợp chất có công thức (V) hoặc một trong số các muối của nó bằng cách thực hiện phản ứng halogen hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình 3

Quy trình 3 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (Angewandte Chemie, International Edition, 52(16), 4440-4444; 2013; ACS Catalysis, 6(11), 7839-7843; 2016; Journal of the American Chemical Society, 2017, 139, 888; Angewandte Chemie, International Edition, 2014, 53, 7928; Journal of the American Chemical Society, 2018, 140, 2789; WO2008156879; WO2012114285).

Quy trình 3 được thực hiện trong sự có mặt của chất halogen hóa và nếu thích hợp, trong sự có mặt của dung môi.

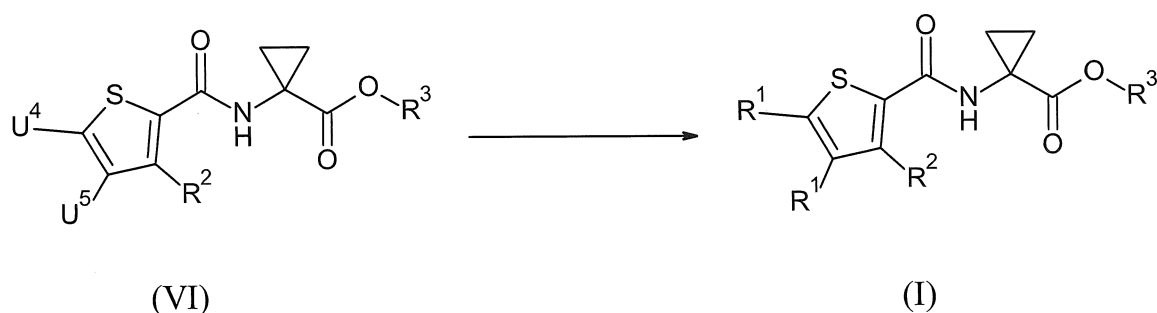
Các chất halogen hóa thích hợp để thực hiện quy trình 3 không bị giới hạn cụ thể với điều kiện là chúng được sử dụng để halogen hóa. Ví dụ về các chất brom hóa bao gồm brom, N-bromosuccinimide và 1,3-dibromo-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione. Các ví dụ về các chất clo hóa bao gồm N-chlorosuccinimide, sulfonyl chloride và 1,3-dichloro-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione. Ví dụ về các chất brom hóa bao gồm iodin, N-iodosuccinimide, iodin chloride và 1,3-diiodo-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione. Ví dụ về các chất flo hóa bao gồm N-fluorenylsulfonimide.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình 3 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ thông thường với điều kiện 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, ví dụ như một số dung môi được bộc lộ đối với quy trình 1. Để thực hiện quy

trình 3, cũng có lợi khi sử dụng axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit trifloaxetic làm dung môi hoặc đồng dung môi. Để thực hiện quy trình 3, cũng có thể có lợi khi sử dụng axit Lewis như kẽm clorua (II) làm chất xúc tác. Để thực hiện quy trình 3, cũng có thể có lợi khi sử dụng các chất xúc tác kim loại chuyển tiếp như các chất xúc tác paladi. Để thực hiện quy trình 3, cũng có thể có lợi khi sử dụng chất phản ứng hữu cơ-kim loại như n-butyllithi.

Quy trình 4

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình 4 bao gồm bước thực hiện quá trình diazo hóa hợp chất có công thức (VI) hoặc một trong số các muối của nó sau đó là sự thể thơm để thu được hợp chất có công thức (I) như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:

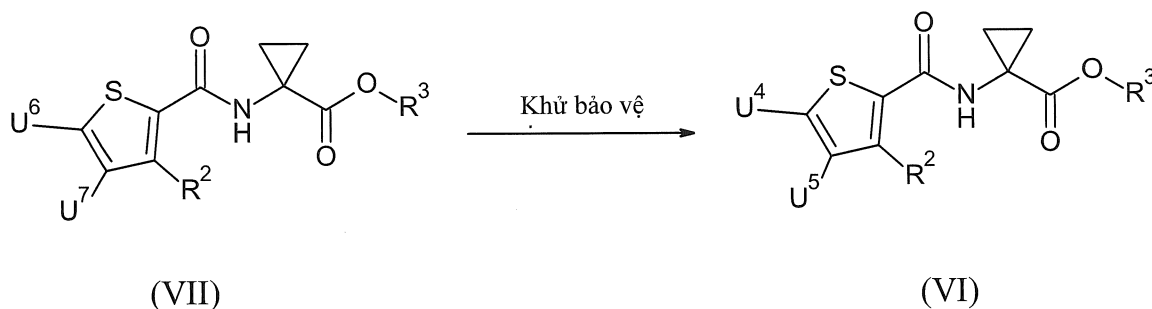


Quy trình 4

trong đó U^4 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom và U^5 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom với điều kiện là ít nhất một trong số U^4 hoặc U^5 là nhóm amino.

Quy trình 4 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 và 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 và các tài liệu tham khảo được trích dẫn trong đó).

Các hợp chất có công thức (VI) 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 (VII) hoặc một trong các muối của nó như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:

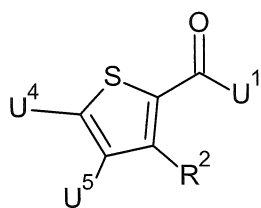


trong đó U^6 là nhóm amino được bảo vệ, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom và U^7 là nhóm amino được bảo vệ, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom với điều kiện là ít nhất một trong số U^6 hoặc U^7 là nhóm amino được bảo vệ, U^4 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom và U^5 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom với điều kiện là ít nhất một trong số U^4 hoặc U^5 là nhóm amino.

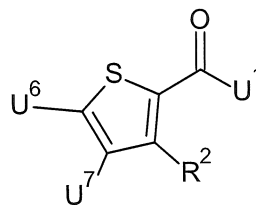
Ví dụ về các nhóm bảo vệ của nhóm amino bao gồm nhóm benzyl, nhóm 4-metoxybenzyl, nhóm alyl, nhóm C_1 - C_6 -alkylsulfonyl không được thế hoặc được thế, triflometylsulfonyl, phenylsulfonyl không được thế hoặc được thế, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, alyloxycarbonyl, nhóm axetyl 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 (VI) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (VIII) hoặc một trong số các muối của nó và các hợp chất có công thức (VII) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IX) hoặc một trong số các muối của nó bằng phản ứng với hợp chất có công thức (II) trong các điều kiện được mô tả trong quy trình 1:



(VIII)



(IX)

trong đó U^4 , U^5 , U^6 và U^7 là như được xác định ở đây, U^1 là nguyên tử halogen, nhóm hydroxy hoặc nhóm C₁-C₆-alkoxy.

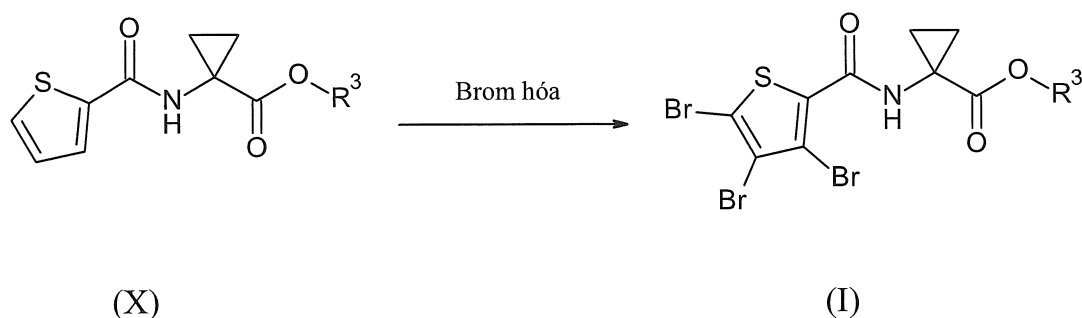
Các hợp chất có công thức (VIII) và các hợp chất có công thức (IX) là có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết rõ với các điều kiện phản ứng tương tự như điều kiện được mô tả để điều chế các hợp chất có công thức (II).

Các hợp chất có công thức (I) hoặc một trong số các muối của nó trong đó R^3 là nguyên tử hydro có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl bằng cách quy trình đã biết rõ như thủy phân bazơ.

Các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (I) hoặc một trong số các muối của nó trong đó R^3 là nguyên tử hydro bằng cách quy trình đã biết rõ.

Quy trình 5

Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng quy trình 5 từ hợp chất có công thức (X) hoặc một trong số các muối của nó bằng cách thực hiện phản ứng brom hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình 5

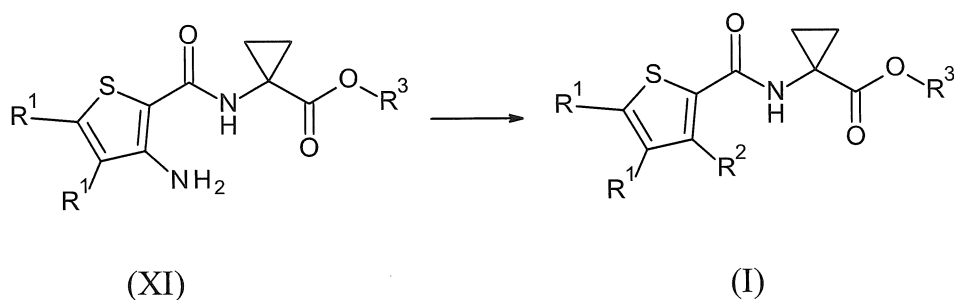
Quy trình 5 được thực hiện trong sự có mặt của chất brom hóa và nếu thích hợp, trong sự có mặt của dung môi.

Các chất brom hóa thích hợp để thực hiện quy trình 5 không bị giới hạn cụ thể với điều kiện là chúng được sử dụng cho quá trình brom hóa. Ví dụ về các chất brom hóa bao gồm N-bromosuccinimide, brom và 1,3-dibromo-5,5-dimethyl-2,4-imidazolidindione.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình 5 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ thông thường với điều kiện 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 mô tả đối với quy trình 2. Để thực hiện quy trình 5, cũng có lợi khi sử dụng axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit trifloaxetic làm dung môi hoặc đồng dung môi. Để thực hiện quy trình 5, cũng có thể có lợi khi sử dụng axit Lewis như kẽm clorua (II) làm chất xúc tác. Để thực hiện quy trình 5, cũng có thể có lợi khi sử dụng chất phản ứng hữu cơ-kim loại như n-butyllithi.

Quy trình 6

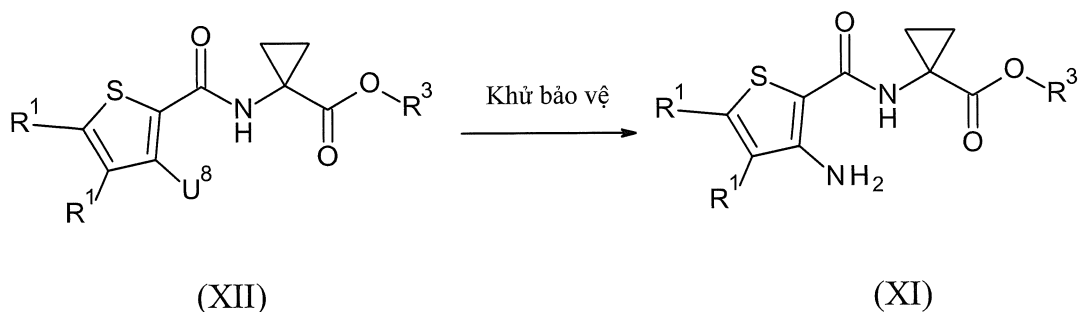
Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được điều chế bằng quy trình 6 từ hợp chất có công thức (XI) như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình 6

Quy trình 6 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 và 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 và các tài liệu tham khảo được trích dẫn trong đó).

Các hợp chất có công thức (XI) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình bao gồm bước loại bảo vệ hợp chất có công thức (XII) bằng phản ứng loại bảo vệ như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



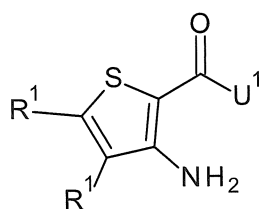
trong đó U⁸ là nhóm amino được bảo vệ.

Ví dụ về các nhóm bảo vệ của nhóm amino bao gồm nhóm benzyl, nhóm 4-metoxymethyl, nhóm allyl, nhóm C₁-C₆-alkylsulfonyl không được thế hoặc được thế, trifluoromethylsulfonyl, phenylsulfonyl không được thế hoặc được thế, C₁-C₆-alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, allyloxycarbonyl, nhóm acetoxymethyl hoặc nhóm trifluoroacetoxymethyl.

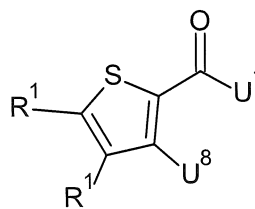
Quy trình loại bảo vệ có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết để loại bỏ nhóm bảo vệ (Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194). Ví dụ, nhóm bảo vệ *tert*-butoxycarbonyl và

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 (XI) cũng có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIII) và các hợp chất có công thức (XII) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XIV) bằng phản ứng với hợp chất có công thức (III) trong các điều kiện được mô tả đối với quy trình 1:



(XIII)



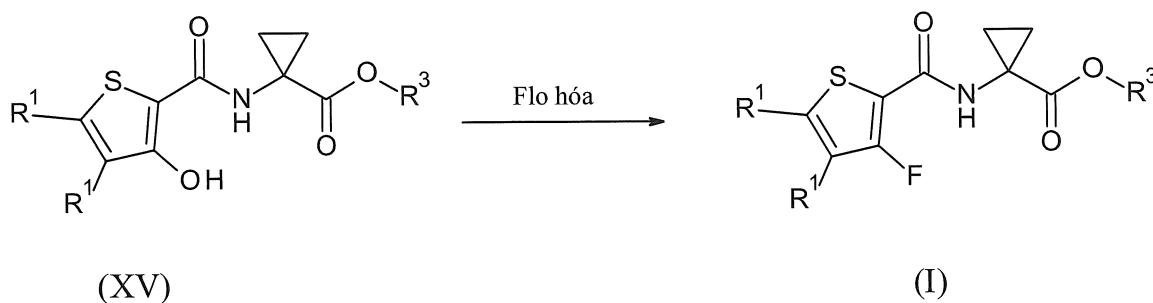
(XIV)

trong đó U⁸ là như được xác định ở đây và U¹ là nguyên tử halogen, nhóm hydroxy hoặc nhóm C₁-C₆-alkoxy.

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

Quy trình 7

Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng quy trình 7 bằng phản ứng flo hóa như được minh họa trong sơ đồ sau đây:



Quy trình 7

Sáng chế cũng đề cập đến quy trình này, trong đó R^1 , R^2 và R^3 là như được nêu trong điểm 1.

Quy trình 7 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (Journal of the American Chemical Society 2011, 133, 11482 và Organic Process Research & Development 2014, 18, 1041).

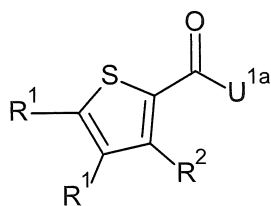
Các hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế theo quy trình được mô tả trên đây. Tuy nhiên cần hiểu rằng, trên cơ sở kiến thức chung của người có hiểu biết trung bình và các công bố có sẵn, người có hiểu biết trung bình có thể thay đổi các quy trình này thích hợp với đặc tính cụ thể của mỗi hợp chất trong số các hợp chất theo sáng chế mà cần được tổng hợp.

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

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

Trừ khi được chỉ ra là khác, trong phần sau đây, R^1 , R^2 và R^3 có cùng nghĩa như được nêu trên đây cho các hợp chất có công thức (I).

Các hợp chất có công thức (IIa) được đề xuất:



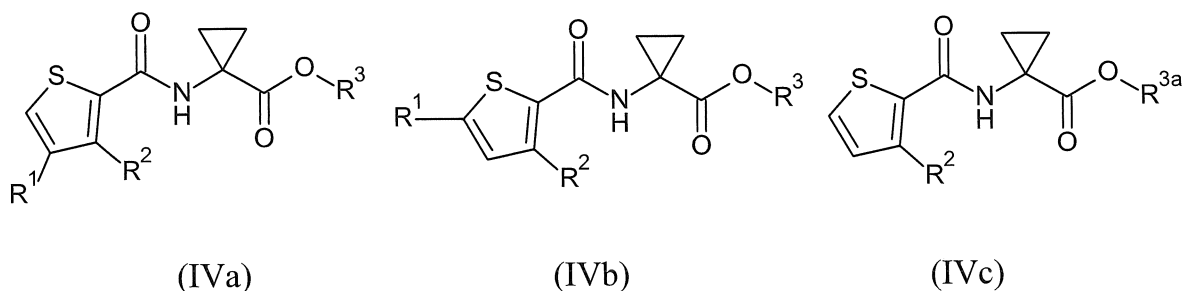
(IIa)

trong đó R^1 , R^2 và R^3 là như được xác định ở đây và U^{1a} là nhóm hydroxy hoặc nhóm C₁-C₆-alkoxy,

với điều kiện là hợp chất có công thức (IIa) không phải là:

- methyl 4,5-diclo-3-flothiophen-2-carboxylat [2166596-88-7],
- axit 4,5-diclo-3-flothiophen-2-carboxylic [2166596-87-6],
- etyl 4,5-dibromo-3-flothiophen-2-carboxylat [2260624-98-2],
- axit 4,5-dibromo-3-flothiophen-2-carboxylic [1628447-64-2],
- methyl 4,5-dibromo-3-clothiophen-2-carboxylat [1501789-47-4],
- axit 4,5-dibromo-3-iodothiophen-2-carboxylic [854626-46-3],
- axit 4,5-dibromo-3-clothiophen-2-carboxylic [503308-99-4],
- etyl 4,5-dibromo-3-clothiophen-2-carboxylat [503308-98-3],
- methyl 4,5-dibromo-3-flothiophen-2-carboxylat [395664-58-1],
- *tert*-butyl 3,4,5-tribromothiophen-2-carboxylat [62224-27-5],
- etyl 3,4,5-tribromothiophen-2-carboxylat [54113-44-9],
- axit 3,4,5-tribromothiophen-2-carboxylic [53317-05-8] và
- methyl 3,4,5-tribromothiophen-2-carboxylat [24647-80-1].

Các hợp chất có công thức (IVa), (IVb) và (IVc) là khía cạnh khác của sáng chế:



trong đó

R¹ là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R² được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R³ 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, heteroaryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heteroxycyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl;

R^{3a} là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxycyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl;

trong đó R³ là heteroxycyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh trong (IVa) và (IVb) khi mỗi R¹ và R² là nguyên tử clo;

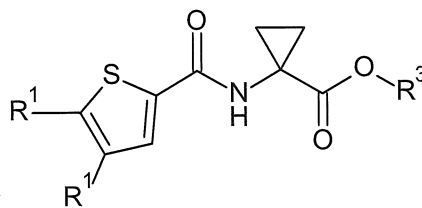
với điều kiện là hợp chất có công thức (IVa) và (IVc) không phải là:

- axit 1-{[(3,4-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic [2140459-54-5],

- metyl 1-{[(3-clo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [2188523-33-1]
và

- metyl 1-{[(3-bromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [2175467-77-1].

Các hợp chất có công thức (V) được đề xuất:



(V)

trong đó

R¹ là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

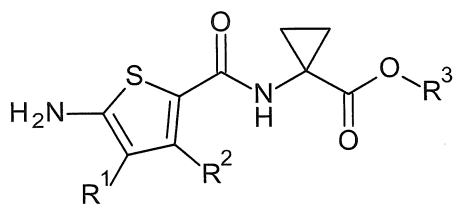
R³ được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl;

trong đó R³ là heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh khi mỗi R¹ và R² là nguyên tử clo;

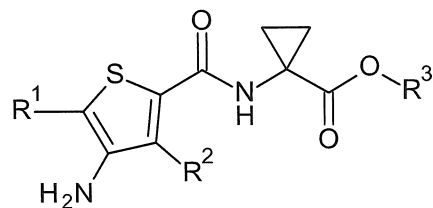
với điều kiện là hợp chất có công thức (V) không phải là:

- axit 1-{[(4,5-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic [726125-69-5],
- but-2-yn-1-yl 1-{[(4,5-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [666857-33-6],
- xyclobutyl 1-{[(4,5-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [666857-32-5],
- propyl 1-{[(4,5-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [666857-31-4] và
- metyl 1-{[(4,5-dibromo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat [666857-30-3].

Các hợp chất có công thức (VIa) và (VIb) là khía cạnh khác của sáng chế:



(VIa)



(VIb)

trong đó

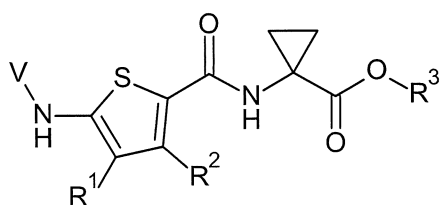
R^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

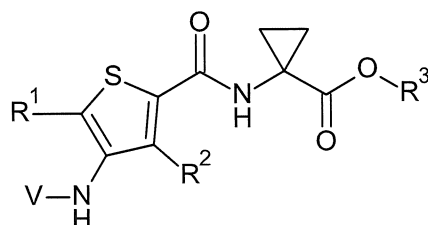
R^3 được chọn từ nhóm bao gồm C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là nguyên tử clo.

Các hợp chất có công thức (VIIa) và (VIIb) được đề xuất:



(VIIa)



(VIIb)

trong đó

R^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

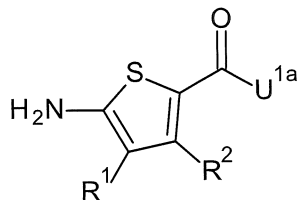
R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R^3 được chọn từ nhóm bao gồm 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, heteroaryl, aralkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, - C_1 - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và - C_1 - C_6 -alkyl-xyclopropyl;

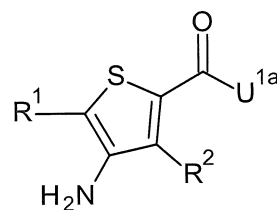
với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là nguyên tử clo;

V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxymethyl, nhóm allyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, alyloxycarbonyl, nhóm acetyl hoặc nhóm trifluoroacetyl.

Các hợp chất có công thức (VIIIa) và (VIIIb) được đề xuất:



(VIIIa)



(VIIIb)

trong đó

R^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

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

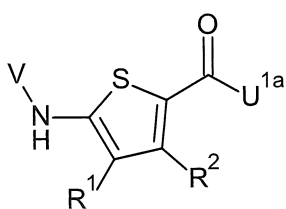
với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo hay nguyên tử flo khi R^1 là nguyên tử clo;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo hay nguyên tử flo khi R^1 là nguyên tử brom;

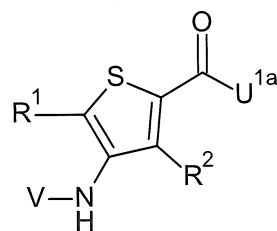
với điều kiện là hợp chất có công thức (VIIIb) không phải là:

- etyl 4-amino-3,5-dibromothiophen-2-carboxylat [1394375-09-7].

Các hợp chất có công thức (IXa) và (IXb) được đề xuất:



(IXa)



(IXb)

trong đó

R^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

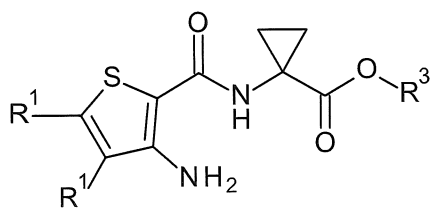
V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxycarbonyl, nhóm allyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, allyloxycarbonyl, nhóm axetyl hoặc nhóm trifloaxetyl và U^{1a} là nhóm hydroxy hoặc nhóm C_1 - C_6 -alkoxy.

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

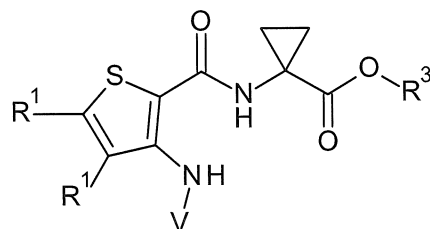
với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo hay nguyên tử flo khi R^1 là nguyên tử clo;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo hay nguyên tử flo khi R^1 là nguyên tử brom.

Các hợp chất có công thức (XI) và (XIIa) được đề xuất:



(XI)



(XIIa)

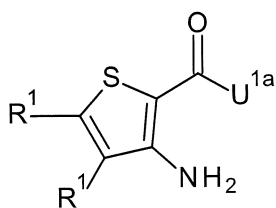
trong đó

V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxymethyl, nhóm allyl, C₁-C₆-alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, allyloxycarbonyl, nhóm acetyl hoặc nhóm trifluoroacetyl;

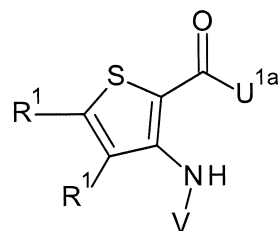
R¹ là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R³ được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-cyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl, aryl, heteroaryl, alkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heterocyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-cyclopropyl.

Các hợp chất có công thức (XIIIa) và (XIVa) được đề xuất:



(XIIIa)



(XIVa)

trong đó

R¹ là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

V là nhóm benzyl, nhóm 4-metoxycarbonyl, nhóm allyl, C₁-C₆-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 C₁-C₆-alkoxy,

với điều kiện là hợp chất có công thức (XIIIa) không phải là:

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

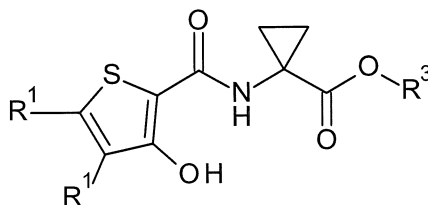
và với điều kiện là hợp chất có công thức (XIVa) không phải là:

- 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 có công thức (XV) là khía cạnh khác của sáng chế:



(XV)

trong đó

R¹ là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R³ được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃ và -C₁-C₆-alkyl-xyclopropyl.

Các chế phẩm và dạng phối chế

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm, cụ thể là chế phẩm để phòng trừ vi sinh vật không mong muốn, bao gồm một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I). Chế phẩm này tốt hơn là chế phẩm diệt nấm.

Chế phẩm này thường chứa một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) và một hoặc nhiều chất mang chấp nhận được, cụ thể là một hoặc nhiều chất mang chấp nhận được trong nông nghiệp.

Chất mang là chất rắn hoặc lỏng, tự nhiên hoặc tổng hợp, hữu cơ hoặc vô cơ mà chúng thông thường ở dạng trơ. Chất mang thường cải thiện được việc áp dụng các hợp chất, chẳng hạn, lên cây, các bộ phận của cây 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, bột 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 bị 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 hydrocarbon thơm và không thơm (như xyclohexan, parafin, alkylbenzen, xylen, toluen alkylnaphtalen, các hydrocarbon 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, este hóa và/hoặc este hóa, như butanol hoặc glycol), các keton (như axeton, metyl etyl keton, 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-alkylpyrrolidon) 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 thường

nằm trong khoảng từ 1 đến 99,99%, tốt hơn là từ 5 đến 99,9%, tốt hơn nữa là từ 10 đến 99,5%, và tốt nhất là từ 20 đến 99% khối lượng của chế phẩm.

Chế phẩm có thể còn chứa một hoặc nhiều chất phụ trợ chấp nhận được mà thường để phối chế chế phẩm (ví dụ các chế phẩm hóa nông), như một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt.

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, các muối của axit lignosulfonic, các muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphthalensulfonic, sản phẩm đa 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 các chất thủy phân protein, dịch thải lignosulphit và methylxenuloza. Chất hoạt động bề mặt thường được sử dụng khi hợp chất có công thức (I) 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 mà thường để phối chế các chế phẩm hóa nông bao gồm chất đẩy nước, chất hút ẩm, chất liên kết (chất kết dính, chất dính, tác nhân cố định, như carboxymethylxenuloza, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt mịn hoặc nhựa, như gôm arabic, rượu polyvinyllic và polyvinyl axetat, các phospholipit tự nhiên như xephalin và lecithin và các phospholipit tổng hợp, polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic 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 dùng dự định hợp chất có công thức (I) 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 này có thể ở dạng chế phẩm tùy chỉnh 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. Hợp chất có công thức (I) có thể có mặt ở dạng huyền phù, nhũ tương hoặc hòa tan.

Chế phẩm có thể được cung cấp cho người sử dụng cuối ở dạng phối chế sẵn dùng, 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 này có thể được cung cấp cho người dùng cuối ở dạng chất cô mà phải được pha loãng, tốt hơn là với nước, trước khi sử dụng.

Chế phẩm này có thể được điều chế theo cách cách thông thường, ví dụ bằng cách trộn hợp chất có công thức (I) với một hoặc nhiều chất phụ trợ thích hợp, như được bộc lộ ở trên đây.

Chế phẩm 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 hợp chất có công thức (I).

(Các) hợp chất và (các) chế phẩm chứa hợp chất này có thể được trộn với các thành phần hoạt tính khác như chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt tuyến trùng, chất diệt côn trùng, chất diệt cỏ, phân bón, chất điều hòa sinh trưởng, chất an toàn hoặc các 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 tuyến trùng và chất diệt khuẩn đã biết được bộc lộ trong tài liệu The Pesticide Manual, 17th Edition.

Các thành phần hoạt tính được nêu cụ thể ở đây bằng tên thông thường của chúng đã biết và được mô tả, ví dụ trong tài liệu The Pesticide Manual (16th Ed. British Crop Protection Council) hoặc có thể được tra cứu trên internet (ví dụ www.alanwood.net/pesticides).

Khi hợp chất (A) hoặc hợp chất (B) có thể có mặt ở dạng hỗn biến, hợp chất này được hiểu trong phần trên và dưới đây còn bao gồm, khi có thể áp dụng được, dạng hỗn biến tương ứng, thậm chí khi các hợp chất này không được đề cập cụ thể trong mỗi trường hợp.

Tất cả các thành phần phối trộn được nêu tên của các nhóm (1) đến (15) có thể, nếu các nhóm chức của chúng cho phép điều này, tùy ý tạo ra các muối với các bazơ hoặc các axit thích hợp.

1) Các chất ức chế quá trình sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.001) xyproconazol, (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 sulfate, (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)xcyclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xcyclopentanol, (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-ylmetyl)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-trifloetoxy)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)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.081) ipfentrifluconazol, (1.082) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.083) 2-[6-(4-bromophenoxy)-2-(triflometyl)-3-pyridyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.084) 2-[6-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)-3-pyridyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.085) 3-[2-(1-cloxypropyl)-3-(3-clo-2-flo-phenyl)-2-hydroxy-propyl]imidazol-4-carbonitril, (1.086) 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-diflophenyl)-1,1-diflo-2-hydroxy-3-(5-thioxo-4H-1,2,4-triazol-1-yl)propyl]-3-pyridyl]oxy]benzonitril, (1.087) N-isopropyl-N'-[5-metoxy-2-metyl-4-(2,2,2-triflo-1-hydroxy-1-phenyletyl)phenyl]-N-metylimidoformamit, (1.088) N'-{5-bromo-2-metyl-6-[(1-propoxypropan-2-yl)oxy]pyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.089) hexaconazol, (1.090) penconazol, (1.091) fenbuconazol.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp tại mức 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 (đồng phân đối ảnh chống epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam (đồng phân đối ảnh chống epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (chất triệt quang chống epime 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp của chất triệt quang đồng epime 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang chống epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (đồng phân đối ảnh đồng epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (đồng phân đối ảnh đồng epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (chất triệt quang đồng 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-carboxamid, (2.025) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamid, (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-carboxamid, (2.028) inpyrfluxam, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamid, (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-carboxamid, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (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-carboxamid, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.038) isofluxypram, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.047) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamid, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (2.050) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid,

(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, (2.058) N-[rac-(1S,2S)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)nicotinamit, (2.059) N-[(1S,2S)-2-(2,4-diclophenyl)xyclobutyl]-2-(triflometyl)nicotinamit.

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức hợp III, ví dụ (3.001) ametotradin, (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-dimetylpen-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) fempicoxamid, (3.026) mandestrobin, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamid, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpen-3-enamit, (3.029) metyl {5-[3-(2,4-dimetylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-metylbenzyl}carbamit, (3.030) metyltetraprol, (3.031) florylpicoxamid.

4) Các chất ức chế quá trình nguyên phân và quá trình phân chia tế bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolit, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazol, (4.007) thiophanat-metyl, (4.008) zoxamit, (4.009) pyridaclometyl, (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, (4.026) fluopimomit.

5) Các hợp chất có khả năng hoạt 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 naphthenat, (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 có khả năng 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-fluoro-3,3,4,4-tetramethyl-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 quá trình sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.001) trixyclozol, (11.002) tolprocab.

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 có khả năng hoạt động dưới dạng chất phân tách, ví dụ (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.

15) Các chất diệt nấm khác được chọn từ nhóm bao gồm (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazol, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) xyflufenamid, (15.009) xymoxanil, (15.010) xyprosulfamid, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothioxyanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomicin, (15.018) natamycin, (15.019) niken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapiprolin, (15.023) oxyfentiin, (15.024) pentaclophenol và các muối, (15.025) axit phosphor và các 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]etanone, (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]quinazolin, (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) ipflufenoquin, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.043) fluoxapiprolin, (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) quinofumelin, (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)thiophene-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)metylpyridin-2-yl}carbamat, (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} carbamat, (15.062) 5-flo-4-imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on, (15.063) aminopyrifen, (15.064) (N'-[2-clo-4-(2-flophenoxy)-5-metylphenyl]-N-etyl-N-metylimidoformamit), (15.065) (N'-(2-clo-5-metyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit), (15.066) (2-{2-[(7,8-diflo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol), (15.067) (5-bromo-1-(5,6-dimetylpyridin-3-yl)-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin), (15.068) (3-(4,4-diflo-5,5-dimetyl-4,5-dihydrothieno[2,3-c]pyridin-7-yl)quinolin), (15.069) (1-(4,5-dimetyl-1H-benzimidazol-1-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin), (15.070) 8-flo-3-(5-flo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolone, (15.071) 8-flo-3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolon, (15.072) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)-8-floquinolin, (15.073) (N-metyl-N-phenyl-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamat), (15.074) metyl {4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl} carbamat, (15.075) (N-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}-xyclopropan-carboxamit), (15.076) N-metyl-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]-benzamat, (15.077) N-[(E)-metoxyiminometyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamat, (15.078) N-[(Z)-metoxyiminometyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamat, (15.079) N-[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-xyclopropan-carboxamit, (15.080) N-(2-flophenyl)-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamat, (15.081) 2,2-diflo-N-metyl-2-[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-axetamit, (15.082) N-allyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]axetamit, (15.083) N-[(E)-N-metoxi-C-metyl-carbonimidoyl]-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]-benzamat, (15.084) N-[(Z)-N-metoxi-C-metyl-carbonimidoyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamat, (15.085) N-allyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-metyl]-propanamit, (15.086) 4,4-dimetyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]-pyrrolidin-2-on, (15.087) N-metyl-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]-benzenecarbothioamit, (15.088) 5-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]pyrrolidin-2-on, (15.089) N-((2,3-diflo-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl)-3,3,3-triflo-propanamit, (15.090) 1-metoxi-1-metyl-3-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-metyl]urea, (15.091) 1,1-dietyl-3-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]urea, (15.092) N-[[4-[5-

(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phen-yl]metyl]propanamit, (15.093) N-metoxo-N-
 [[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]xyclopropancarboxamit,
 (15.094) 1-metoxo-3-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl]metyl]urea, (15.095) N-metoxo-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl]-metyl]-xyclopropan-carboxamit, (15.096) N,2-dimetoxo-N-[[4-[5-
 (triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-metyl]-propanamit, (15.097) N-etyl-2-
 metyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]-propanamit, (15.098)
 1-metoxo-3-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]-metyl]-urea,
 (15.099) 1,3-dimetoxo-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]urea,
 (15.100) 3-etyl-1-metoxo-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl]metyl]urea, (15.101) 1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl]metyl]piperidin-2-on, (15.102) 4,4-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-
 oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isooxazolidin-3-on, (15.103) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-
 (triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isoxazolidin-3-on, (15.104) 3,3-
 dimetyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]-phenyl]-metyl]-piperidin-2-on,
 (15.105) 1-[[3-flo-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl)-phenyl]-metyl]-azepan-2-
 on, (15.106) 4,4-dimetyl-2-[[4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl)-phenyl]-metyl]isoxazolidin-3-on, (15.107) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-
 oxadiazol-3-yl]-phenyl]metyl]isoxazolidin-3-on, (15.108) etyl 1-{4-[5-(triflometyl)-
 1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}-1H-pyrazol-4-carboxylat, (15.109) N,N-dimetyl-1-{4-[5-
 (triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}-1H-1,2,4-triazol-3-amin, (15.110) N-{2,3-
 diflo-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}butanamit, (15.111) N-(1-
 metylxyclopropyl)-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.112) N-(2,4-
 diflophenyl)-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.113) 1-(5,6-
 dimetylpyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.114) 1-(6-
 (diflometyl)-5-metyl-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin,
 (15.115) 1-(5-(flometyl)-6-metyl-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-
 dihydroisoquinolin, (15.116) 1-(6-(diflometyl)-5-metoxo-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-
 dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.117) 4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl dimetylcarbamit, (15.118) N-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-
 yl]phenyl}propanamit, (15.119) 3-[2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-
 yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl

metansulfonat, (15.120) 9-flo-3-[2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl
 metansulfonat, (15.121) 3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl
 metansulfonat, (15.122) 3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-9-flo-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl
 metansulfonat, (15.123) 1-(6,7-dimetylpyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.124) 8-flo-N-(4,4,4-triflo-2-metyl-1-phenylbutan-2-yl)quinolin-3-carboxamit, (15.125) 8-flo-N-[(2S)-4,4,4-triflo-2-metyl-1-phenylbutan-2-yl]quinolin-3-carboxamit, (15.126) N-(2,4-dimetyl-1-phenylpentan-2-yl)-8-floquinolin-3-carboxamit và (15.127) N-[(2S)-2,4-dimetyl-1-phenylpentan-2-yl]-8-floquinolin-3-carboxamit.

Khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến một hoặc nhiều tổ hợp hợp chất sau đây:

(I.01) + (1.001), (I.01) + (1.002), (I.01) + (1.003), (I.01) + (1.004), (I.01) + (1.005), (I.01) + (1.006), (I.01) + (1.007), (I.01) + (1.008), (I.01) + (1.009), (I.01) + (1.010), (I.01) + (1.011), (I.01) + (1.012), (I.01) + (1.013), (I.01) + (1.014), (I.01) + (1.015), (I.01) + (1.016), (I.01) + (1.017), (I.01) + (1.018), (I.01) + (1.019), (I.01) + (1.020), (I.01) + (1.021), (I.01) + (1.022), (I.01) + (1.023), (I.01) + (1.024), (I.01) + (1.025), (I.01) + (1.026), (I.01) + (1.027), (I.01) + (1.028), (I.01) + (1.029), (I.01) + (1.030), (I.01) + (1.031), (I.01) + (1.032), (I.01) + (1.033), (I.01) + (1.034), (I.01) + (1.035), (I.01) + (1.036), (I.01) + (1.037), (I.01) + (1.038), (I.01) + (1.039), (I.01) + (1.040), (I.01) + (1.041), (I.01) + (1.042), (I.01) + (1.043), (I.01) + (1.044), (I.01) + (1.045), (I.01) + (1.046), (I.01) + (1.047), (I.01) + (1.048), (I.01) + (1.049), (I.01) + (1.050), (I.01) + (1.051), (I.01) + (1.052), (I.01) + (1.053), (I.01) + (1.054), (I.01) + (1.055), (I.01) + (1.056), (I.01) + (1.057), (I.01) + (1.058), (I.01) + (1.059), (I.01) + (1.060), (I.01) + (1.061), (I.01) + (1.062), (I.01) + (1.063), (I.01) + (1.064), (I.01) + (1.065), (I.01) + (1.066), (I.01) + (1.067), (I.01) + (1.068), (I.01) + (1.069), (I.01) + (1.070), (I.01) + (1.071), (I.01) + (1.072), (I.01) + (1.073), (I.01) + (1.074), (I.01) + (1.075), (I.01) + (1.076), (I.01) + (1.077), (I.01) + (1.078), (I.01) + (1.079), (I.01) + (1.080), (I.01) + (1.081), (I.01) + (1.082), (I.01) + (1.083), (I.01) + (1.084), (I.01) + (1.085), (I.01) + (1.086), (I.01) + (1.087), (I.01) + (1.088), (I.01) + (1.089), (I.01) + (1.090), (I.01) +

48

(10.001), (I.01) + (10.002), (I.01) + (10.003), (I.01) + (11.001), (I.01) + (11.002), (I.01)
 + (12.001), (I.01) + (12.002), (I.01) + (12.003), (I.01) + (12.004), (I.01) + (13.001), (I.01)
 + (13.002), (I.01) + (13.003), (I.01) + (13.004), (I.01) + (13.005), (I.01) + (13.006), (I.01)
 + (14.001), (I.01) + (14.002), (I.01) + (15.001), (I.01) + (15.002), (I.01) + (15.003), (I.01)
 + (15.004), (I.01) + (15.005), (I.01) + (15.006), (I.01) + (15.007), (I.01) + (15.008), (I.01)
 + (15.009), (I.01) + (15.010), (I.01) + (15.011), (I.01) + (15.012), (I.01) + (15.013), (I.01)
 + (15.014), (I.01) + (15.015), (I.01) + (15.016), (I.01) + (15.017), (I.01) + (15.018), (I.01)
 + (15.019), (I.01) + (15.020), (I.01) + (15.021), (I.01) + (15.022), (I.01) + (15.023), (I.01)
 + (15.024), (I.01) + (15.025), (I.01) + (15.026), (I.01) + (15.027), (I.01) + (15.028), (I.01)
 + (15.029), (I.01) + (15.030), (I.01) + (15.031), (I.01) + (15.032), (I.01) + (15.033), (I.01)
 + (15.034), (I.01) + (15.035), (I.01) + (15.036), (I.01) + (15.037), (I.01) + (15.038), (I.01)
 + (15.039), (I.01) + (15.040), (I.01) + (15.041), (I.01) + (15.042), (I.01) + (15.043), (I.01)
 + (15.044), (I.01) + (15.045), (I.01) + (15.046), (I.01) + (15.047), (I.01) + (15.048), (I.01)
 + (15.049), (I.01) + (15.050), (I.01) + (15.051), (I.01) + (15.052), (I.01) + (15.053), (I.01)
 + (15.054), (I.01) + (15.055), (I.01) + (15.056), (I.01) + (15.057), (I.01) + (15.058), (I.01)
 + (15.059), (I.01) + (15.060), (I.01) + (15.061), (I.01) + (15.062), (I.01) + (15.063),
 (I.01) + (15.064), (I.01) + (15.065), (I.01) + 15.066, (I.01) + (15.067), (I.01) + (15.068),
 (I.01) + (15.069) , (I.01) + (15.070), (I.01) + (15.071), (I.01) + (15.072), (I.01) +
 (15.073), (I.01) + (15.074), (I.01) + (15.075), (I.01) + (15.076), (I.01), (I.01) + (15.077),
 (I.01) + (15.078), (I.01) + (15.079), (I.01) + (15. 080), (I.01) + (15.081), (I.01) +
 (15.082), (I.01) + (15.083), (I.01) + (15.084), (I.01) + (15.085), (I.01) + (15.086), (I.01)
 + (15.087), (I.01) + (15.088), (I.01) + (15.089), (I.01) + (15.090), (I.01) + (15.091) ,
 (I.01) + (15.092), (I.01) + (15.093), (I.01) + (15.094), (I.01) + (15.095), (I.01) + (15.096),
 (I.01) + (15.097), (I.01) + (15.098), (I.01) + (15.099), (I.01) + (15.100), (I.01) + (15.101),
 (I.01) + (15.102), (I.01) + (15.103), (I.01) + (15.104), (I.01) + (15.105), (I.01) + (15.106)
 , (I.01) + (15.107), (I.01) + (15.108), (I.01) + (15.109), (I.01) + (15.110), (I.01) +
 (15.111), (I.01) + (15.112), (I.01) + (15.113), (I.01) + (15.114), (I.01) + (15.115), (I.01)
 + (15.116), (I.01) + (15.117), (I.01) + (15.118), (I.01) + (15.119), (I.01) + (15.120) ,
 (I.01) + (15.121), (I.01) + (15.122), (I.01) + (15.123) , (I.01) + (15.124), (I.01) +
 (15.125), (I.01) + (15.126), (I.01) + (15.127).

Trong các tổ hợp này, thành phần thứ nhất là hợp chất có công thức (I) như được xác định trong bảng I.1 (ví dụ I.01) và thành phần thứ hai là chất diệt nấm được chọn trong các nhóm từ 1 đến 15 như được xác định trong bản mô tả này. Ví dụ, tổ hợp (I.01) + (1.001) tương ứng với tổ hợp bao gồm hợp chất I.01 trong bảng I.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 (I.01) được thay thế bằng hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất được nêu trong bảng I.1.

Các hợp chất có công thức (I), 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 (I): chất diệt nấm được chọn từ nhóm (1) đến (15)), hoặc từ 50:1 đến 1:50, hoặc từ 20:1 đến 1:20. Ví dụ tiếp theo về các khoảng 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 xác định trong bản mô tả này có thể được bổ sung vào các tổ hợp hợp chất.

Các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng có thể được kết hợp với một hoặc nhiều chất kiểm soát sinh học.

Ví dụ về các chất kiểm soát sinh học mà có thể được kết hợp với các hợp chất có công thức (I) và chế phẩm chứa chúng là:

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

(A1) vi khuẩn, như (A1,1) *Bacillus subtilis*, cụ thể 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 bằng sáng chế Mỹ số 6,060,051); (A1,2) *Bacillus amyloliquefaciens*, cụ thể 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 bằng sáng chế Mỹ số 7,094,592); (A1,3) *Bacillus pumilus*, cụ thể 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 bằng sáng chế quốc tế số WO 2016/154297; và

(A2) nấm, như (A2,1) *Aureobasidium pullulans*, cụ thể là các bào tử chồi của chủng DSM14940; (A2,2) *Aureobasidium pullulans* các bào tử chồi của chủng DSM 14941; (A2,3) *Aureobasidium pullulans*, cụ thể 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*, cụ thể 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 bằng sáng chế Mỹ số 6,060,051); (B1.2) *Bacillus pumilus*, cụ thể 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 bằng sáng chế Mỹ số 6,245,551); (B1.3) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng GB34 (có sẵn ở dạng Yield Shield® từ Bayer AG, DE); (B1.4) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng BU F-33 (có mã truy cập NRRL là 50185); (B1.5) *Bacillus amyloliquefaciens*, cụ thể 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 bằng sáng chế Mỹ số 7,094,592); (B1.6) *Bacillus subtilis* Y1336 (có sẵn ở dạng BIOBAC® WP từ Bion-Tech, Đài Loan, 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 Crop Protection, 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 TGA1 hoặc WG từ Certis USA); (B1.11) *Bacillus licheniformis*, cụ thể 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 bằng sáng chế quốc tế số WO 2016/154297.

Theo một số phương án, tác nhân kiểm soát sinh học là chủng *Bacillus subtilis* hoặc *Bacillus amyloliquefaciens* mà 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, số đăng ký US EPA 71840-8); *Bacillus subtilis* Y1336 (có sẵn ở dạng BIOBAC® WP từ Bion-Tech, Đài Loan, 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*, cụ thể 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 Crop Protection, 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*, cụ thể là chủng CON/M/91-8 (mã truy cập số DSM-9660; ví dụ, Contans ® từ Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, cụ thể 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 của 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*, cụ thể 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 của Mycontrol); (B2,52) *Trichoderma virens* (cũng được biết là *Gliocladium virens*), cụ thể là chủng GL-21 (ví dụ, SoilGard 12G của Certis, US); (B2,53) *Trichoderma viride*, chủng TV1 (ví dụ, Trianum-P của Koppert); (B2,54) *Ampelomyces quisqualis*, cụ thể là chủng AQ 10 (ví dụ, AQ 10® của IntrachemBio Italia); (B2,56) *Aureobasidium pullulans*, cụ thể là các bào tử chồi của chủng DSM14940; (B2,57) *Aureobasidium pullulans*, cụ thể là các bào tử chồi của chủng DSM 14941; (B2,58) *Aureobasidium pullulans*, cụ thể là hỗn hợp của các bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM 14941 (ví dụ, Botector® của bio-ferm, CH); (B2,64) *Cladosporium cladosporioides*, chủng H39 (của Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2,69) *Gliocladium catenulatum* (Đồng nghĩa: *Clonostachys rosea* f. *catenulate*), chủng J1446 (ví dụ, Prestop® của AgBio Inc. và ví dụ, Primastop® của Kemira Agro Oy); (B2,70) *Lecanicillium lecanii* (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*) conidia của chủng KV01 (ví dụ, Vertalec® của 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 của AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2,79) *Trichoderma harzianum*, chủng DB 103 (ví dụ, T-Gro 7456 của Dagut Biolab); (B2,80) *Trichoderma polysporum*, chủng IMI 206039 (ví dụ, Binab TF WP của BINAB Bio-Innovation AB, Thụy Điển); (B2,81) *Trichoderma stromaticum* (ví

dụ, Tricovab của Ceplac, Brazil); (B2,83) *Ulocladium oudemansii*, cụ thể là chủng HRU3 (ví dụ, Botry-Zen® của Botry-Zen Ltd, NZ); (B2,84) *Verticillium albo-atrum* (trước đây là *V. dahliae*), chủng WCS850 (CBS 276,92; ví dụ, Dutch Trig của 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 các tác nhân kiểm soát sinh học mà có thể kết hợp với các hợp chất có công thức (I) và chế phẩm chứa các hợp chất này là:

vi khuẩn được chọn từ nhóm bao gồm *Bacillus cereus*, cụ thể 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*, cụ thể là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), chủng AM65-52 (mã truy cập số ATCC 1276), *B. thuringiensis subsp. aizawai*, cụ thể 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*, cụ thể là chủng ATCC 74040, *Lecanicillium spp.*, cụ thể là chủng HRO LEC 12, *Metarhizium anisopliae*, cụ thể là chủng F52 (DSM3884 hoặc ATCC 90448), *Paecilomyces fumosoroseus* (hiện nay: *Isaria fumosorosea*), cụ thể là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (mã truy cập ATCC 20874), và *Paecilomyces lilacinus*, cụ thể 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 'chất đề chủng' cho cây hoặc các bộ phận của cây hoặc các cơ quan của cây và nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của cây và sức khỏe của cây. Các ví dụ là: *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, cụ thể là *Burkholderia cepacia* (trước đây gọi là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, cụ thể 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 chất kiểm soát 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.

Ví dụ về chất diệt côn trùng, chất diệt ve bét và chất diệt giun tròn, mà lần lượt có thể được kết hợp với các hợp chất có công thức (I) và chế phẩm chứa chúng là:

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ, các loại cacbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc phosphat hữu cơ, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, cloretoxyfos, clorfenvinphos, clormephos, clorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon,

diclofos/DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazat, heptenophos, imixyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

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

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ các pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin s-xycllopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, beta-xypermethrin, theta-xypermethrin, zeta-xypermethrin, chất đồng phân xyphenothrin [(1R)-trans], deltamethrin, chất đồng phân empenthrin [(EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinat, flumethrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momflothrin, 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 nicotin (nicotinic acetylcholin 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 chloride channel - GluCl), ví dụ như, avermectin/milbemycin, ví dụ abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.
- (7) Chất bắt chước hormon ấu trùng, ví dụ như, chất tương tự hormon 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 sulfuric 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* phân loài *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 azoxyclofen, 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, fluxyclofenuron, 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 ecdyson, ví dụ như, chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit và tebufenozit.
- (19) Chất chủ vận thụ thể octopamin ví dụ như, amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể, ví dụ như hydrametylnon hoặc axequinoxyl hoặc fluacrypyrim.
- (21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức 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 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 II ty thể, ví dụ như các dẫn xuất *beta*-ketonitril, ví dụ, xyenopyrafen và xyflumetofen và carboxanilit, ví dụ như pyflubumit.
- (28) Chất điều biến thụ thể ryanodin, ví dụ như, các diamit, ví dụ, clorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit,
- các hợp chất hoạt động khác, ví dụ như, Afidopyropen, Afoxolaner, Azadirachtin, Benclothiaz, Benzoximat, Bifenazat, Broflanilit, Bromopropylat, Chinomethionat, Cloroprallethrin, Cryolit, Xyclaniliprol, Xyclozaprid, Cyhalodiamit, Dicloromezotiaz, Dicofol, 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, Tetraniliprol, Tetrachlorantraniliprol, Tigolaner, Tioxazafen, Thiofluoximat, Triflumezopyrim và iodomethan; ngoài ra, các chế phẩm dựa trên *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và cả các hợp chất sau đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã 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 (đã 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 (đã 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 (đã 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 (đã biết từ EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpyridin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết từ WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết từ JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (đã 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 (đã biết từ WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentaflloetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết từ WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoil)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã 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)-benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(trans-1-oxido-3-thietanyl)-benzamit và 4-[(5S)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit (đã biết từ WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit, (+)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit và (-)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-

propanamit (đã 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 (đã 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, đã 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 (đã 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 (đã 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 (đã 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 (đã 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-xyclopropanocarboxylic (đã biết từ CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); este metyl 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 (đã 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-pentafluoetoxi)phenyl]-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]- α -L-mannopyranoza (đã biết từ US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3.2.1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-*anti*)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3.2.1]octan (CAS 933798-27-7), (8-*syn*)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometyl-phenoxy)-3-(6-triflometyl-pyridazin-3-yl)-3-aza-bixyclo[3.2.1]octan (đã biết từ WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), *N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]-propanamit (đã biết từ WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và *N*-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(metylamino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (đã biết từ CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)-4-[[4-(triflometyl)phenyl]metoxy]-pyrimidin (đã biết từ WO 2013/115391 A1) (CAS

1449021-97-9), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1-metyl-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết từ WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-1,8-diazaspiro[4.5]decan-2,4-dion (đã biết từ WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), este etyl của axit 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-carbonic (đã 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-axetamid (đã 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-axetamid, (đã 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-axetamid, (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-propoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[[5-(triflometyl)-2-pyridinyl]oxy]-9-azabicyclo[3.3.1]nonan (đã biết từ WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

Ví dụ về chất tăng cường độ tương thích của cây trồng mà có thể được kết hợp với các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng là, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-metyl), xyometrinil, xyprosulphamid, dichlormid, fenclorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mephenpyr (-dietyl), naphthalic anhydrit, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoyl)amino]phenyl}sulfonyl)benzamid (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).

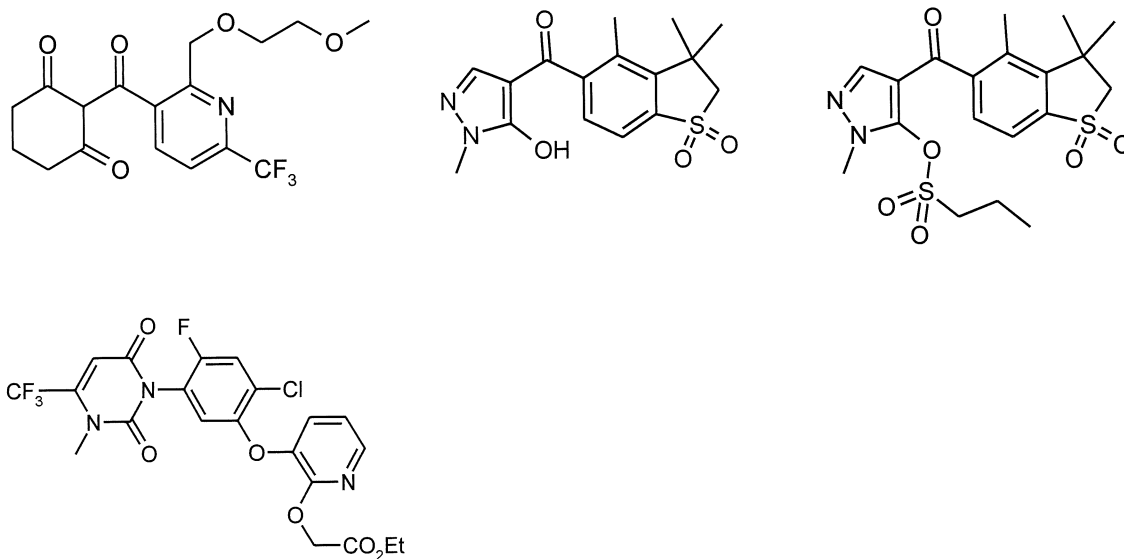
Ví dụ về chất diệt cỏ mà có thể được kết hợp với các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng là:

axetochlor, acifluorfen, acifluorfen-natri, aclonifen, alachlor, allidochlor, alloxydim, alloxydim-natri, ametryn, amicarbazone, 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, amonisulfamat, anilofos, asulam, atrazin, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-etyl, benfluralin, benfuresat, bensulfuron, bensulfuron-metyl,

bensulit, bentazon, benzobixyclon, benzo fenap, bixyclopyron, bifenox, bilanafos, bilanafos-natri, bispyribac, bispyribac-natri, bromacil, bromobutit, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil-buty rat, -kali, -heptanoat, và -octanoat, busoxinon, butachlor, butafenacil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylat, cafenstrole, carbetamit, carfentrazone, carfentrazone-etyl, chloramben, chlorbromuron, chlorfenac, chlorfenac-natri, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-metyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-etyl, clophthalim, clotoluron, chlorthal-dimetyl, chlorsulfuron, cinidon, cinidon-etyl, cinmetylin, cinosulfuron, clacyfos, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clomazone, clomeprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-metyl, cumyluron, xyanamit, xyanazin, xycloat, xyclopyrimorat, xyclosulfamuron, xycloxydim, xyhalofop, xyhalofop-butyl, xyprazin, 2,4-D, 2,4-D-butotyl, -butyl, -dimetylamoni, -diolamin, -etyl, -2-etylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylamoni, -kali, -triisopropanolamoni, và -trolamin, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimetylamoni, -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, dimethenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramin, dinoterb, diphenamid, diquat, diquat-dibromid, dithiopyr, diuron, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethiozin, ethofumesa, etoxyfen, etoxyfen-etyl, etoxysulfuron, etobenzanid, F-9600, F-5231, tức là $N\{-2\text{-clo-4-flo-5-[4-(3-flopropyl)-5-oxo-4,5-dihydro-1H-tetrazol-1-yl]phenyl}\}$ etansulfonamit, F-7967, tức là $3\text{-[7-clo-5-flo-2-(triflometyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dione}$, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, fenoxaprop-P-etyl, fenoxasulfon, fenquino trion, fentrazamit, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl, flucarbazon, flucarbazon-natri, flucetosulfuron, fluchloralin, flufenaxet, flufenpyr, flufenpyr-etyl, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butyl, -dimetylamoni và -metyl, floglycofen, floglycofen-etyl, flupropanat, flupyr sulfuron, flupyr sulfuron-metyl-natri, fluridon, flurochloridon,

fluroxypyr, fluroxypyr-metyl, flurtamon, fluthiaxet, fluthiaxet-metyl, fomesafen, fomesafen-natri, foramsulfuron, fosamin, glufosinat, glufosinat-amoni, glufosinat-P-natri, glufosinat-P-amoni, glufosinat-P-natri, glyphosat, glyphosat-amoni, -isopropylamoni, -diamoni, -dimetylamoni, -kali, -natri, và -trimesium, H-9201, tức là O-(2,4-dimetyl-6-nitrophenyl) O-etyl isopropylphosphoramidothioat, halauxifen, halauxifen-metyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-etoxyetyl, haloxyfop-P-etoxyetyl, haloxyfop-metyl, haloxyfop-P-metyl, hexazinon, HW-02, tức là 1-(dimetoxylphosphoryl) etyl-(2,4-diclophenoxy)axetat, imazamethabenz, imazamethabenz-metyl, imazamox, imazamox-amoni, imazapic, imazapic-amoni, imazapyr, imazapyr-isopropylamoni, imazaquin, imazaquin-amoni, imazethapyr, imazethapyr-immonium, 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-butetyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, -isopropylamoni, -kali, và -natri, MCPB, MCPB-metyl, -etyl và -natri, mecoprop, mecoprop-natri, và -butetyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butetyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, và -kali, mefenaxet, mefluidit, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, metabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, 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 (các axit béo), orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paraquat, paraquat diclorit, pebulat, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorophenol, pentoxazon, pethoxamid, dầu mỡ, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-metyl, prodiamin, profoxydim, prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazin, propham, propisochlor, propoxycarbazon,

propoxycarbazone-natri, propyrisulfuron, propyzamit, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclostrobin, pyraflufen, pyraflufen-ethyl, pyrasulfotol, pyrazolynat (pyrazolat), pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridat, pyrifthalid, pyriminobac, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyriothiobac, pyriothiobac-natri, pyroxasulfone, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinclamin, quizalofop, quizalofop-ethyl, quizalofop-P, quizalofop-P-ethyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, setoxydim, 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 tricloaxetic), TCA-natri, tebuthiuron, tefuryltrion, tembotrion, tepraloxymid, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbuthylazin, terbutryn, thenylchlor, thiazopyr, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, thiobencarb, tiafenacil, tolpyralat, topramezon, tralkoxydim, triafamon, tri-allate, 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:

Axibenzolar, acibenzolar-S-metyl, axit 5-aminolevulinic, anxymidol, 6-benzylaminopurin, Brassinolid, catechin, cloromequat clorua, cloprop, xyclanilit, axit 3-(xycloprop-1-enyl) propionic, daminozit, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-natri, endothal, endothal-dikali, -dinatri, và -mono(N,N-dimetylalkylamoni), ethephon, flumetralin, flurenol, flurenol-butyl, flurprimidol, forclorfenuron, axit gibberellic, inabenfit, axit indol-3-axetic (IAA), axit 4-indol-3-ylbutyric, isoprothiolan, probenazol, axit jasmonic, maleic hydrazit, mepiquat clorua, 1-metylxyclopropen, metyl jasmonat, 2-(1-naphtyl)axetamit, axit 1-naphtylaxetic, axit 2-naphtyloxyaxetic, hỗn hợp nitrophenolat, paclobutrazol, N-(2-phenyletyl)-beta-alanin, axit N-phenylphtalamic, 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 có công thức (I) và các chế phẩm chứa các hợp chất này có hoạt tính diệt vi sinh vật tiềm năng. Các hợp chất và chế phẩm này có thể được sử dụng để phòng trừ vi sinh vật không mong muốn, như nấm và vi khuẩn không mong muốn. Chúng có thể đặc biệt hữu ích trong bảo vệ cây trồng (chúng kiểm soát các vi sinh vật gây ra các bệnh ở thực vật) hoặc để bảo vệ vật liệu (ví dụ, vật liệu công nghiệp, gỗ, hàng hóa lưu kho) như được mô tả chi tiết hơn dưới đây. Cụ thể hơn, các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng có thể được sử dụng để bảo vệ hạt, hạt nảy mầm, cây con đã nhú mầm, cây, các bộ phận của cây, quả, sản phẩm thu hoạch và/hoặc đất trên đó thực vật sinh trưởng khỏi các vi sinh vật không mong muốn.

Thuật ngữ kiểm soát hoặc việc kiểm soát như được sử dụng ở đây bao gồm việc xử lý mang tính bảo vệ, chữa trị và tiêu diệt tận gốc các vi sinh vật không mong muốn. Các vi sinh vật không mong muốn có thể là vi khuẩn gây bệnh, virus gây bệnh, nấm mốc gây bệnh hoặc nấm gây bệnh, cụ thể hơn là vi khuẩn gây bệnh trên thực vật, virus gây bệnh trên thực vật, nấm mốc gây bệnh trên thực vật hoặc nấm gây bệnh trên thực vật.

Như được mô tả chi tiết sau đây, các vi sinh vật gây bệnh trên thực vật này là nguyên nhân của rất nhiều bệnh ở thực vật.

Cụ thể hơn, các hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng có thể được sử dụng làm chất diệt nấm. Đối với mục đích của bản mô tả, thuật ngữ “chất diệt nấm” để chỉ hợp chất hoặc chế phẩm mà có thể được sử dụng trong bảo vệ cây trồng để kiểm soát nấm không mong muốn, như Plasmodiophoromycete, Chytridiomycete, Zygomycete, Ascomycete, Basidiomycete và Deuteromycete và/hoặc để kiểm soát Oomycete, tốt hơn là để kiểm soát Basidiomycete (gây bệnh rỉ sắt).

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp kiểm soát vi sinh vật không mong muốn, như nấm, nấm mốc và vi khuẩn gây bệnh thực vật, bao gồm bước áp dụng ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc ít nhất một chế phẩm chứa chúng cho vi sinh vật và/hoặc môi trường sống của chúng (cho cây, các bộ phận của cây, hạt, quả hoặc vào đất mà cây phát triển trên đó).

Thông thường, khi các hợp chất và các chế phẩm theo sáng chế được sử dụng trong các phương pháp chữa trị hoặc bảo vệ để kiểm soát nấm gây bệnh thực vật và/hoặc nấm mốc gây bệnh thực vật, lượng hiệu quả và tương thích với thực vật của nó được áp dụng lên cây, các bộ phận của cây, quả, hạt hoặc lên đất hoặc nền mà cây 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, cụ thể 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 xốp polyme hoặc dạng hạt nhựa. Lượng hữu hiệu và tương thích với thực vật nghĩa là lượng đủ để kiểm soát hoặc tiêu diệt nấm 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 nấm được phòng trừ, loại cây trồng, giai đoạn sinh trưởng của cây trồng, điều kiện khí hậu và 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.

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Các hợp chất có công thức (I) và chế phẩm chứa chúng có thể được áp dụng 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 cây hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (gồm cả cây trồng mọc 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.

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, hoa và rễ, ví dụ bao gồm lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thể quả, quả và hạt, và cả 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 ươm), *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 *Graminae* 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.

Theo một số phương án được ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và các loài trồng hoặc các loại thu được bằng phương pháp nhân giống sinh học thông thường, như lai chéo hoặc dung hợp thể nguyên sinh, và cả các bộ phận của chúng, được xử lý theo các phương pháp của sáng chế.

Theo một số phương án được ưu tiên khác, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng cũng được xử lý bằng các phương pháp theo sáng chế. Tốt hơn nữa là, các cây của loài canh tác mà có bán sẵn hoặc đang sử dụng được xử lý theo sáng chế. 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. Thực vật có thể là giống cây trồng, giống canh tác, các kiểu sinh học hoặc kiểu gen

Phương pháp theo sáng chế có thể được sử dụng trong xử lý sinh vật biến đổi gen (GMO), ví dụ, thực vật hoặc hạt. Thực vật biến đổi gen (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. Sự diễn đạt "gen dị hợp" về cơ bản có nghĩa là gen mà được cung cấp hoặc được thu thập bên ngoài thực vật và khi được đưa vào trong nhân, bộ gen lục lạp hoặc ti thể mang đến cho thực vật được biến nạp 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 quan tâm 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 – ARNi hoặc công nghệ ARN nhỏ – miARN). 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.

Thực vật và giống thực vật có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm tất cả các thực vật có vật liệu di truyền mà chúng truyền các tính trạng hữu

dụng, đặc biệt có lợi cho các thực vật này (bất luận thu được bằng phương pháp chọn giống và/hoặc phương pháp công nghệ sinh học hay không).

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 được tăng cường. Năng suất được nâng 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 gióng, 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 mẩy, 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 canh tác mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã bộc lộ trên đây bao gồm thực vật và giống canh tác mà là các cây lai mà thể hiện đặc tính ưu thế lai hoặc sức khỏe cây 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 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 cũng 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 canh tác (thu được bằng phương pháp công nghệ sinh học thực vật như thiết kế di truyền) mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống canh tác, chẳng hạn như cây cải dầu hoặc cây thuộc họ Brassica liên quan với các đặc tính về dầu 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.

Mầm bệnh và bệnh

Các phương pháp được mô tả trên đây có thể được sử dụng để phòng trừ các vi sinh vật, cụ thể là vi sinh vật gây bệnh thực vật như nấm gây bệnh thực vật, gây ra các bệnh như:

bệnh do mầm bệnh phấn trắng gây ra, như loài *Blumeria* (ví dụ *Blumeria graminis*), loài *Podosphaera* (ví dụ *Podosphaera leucotricha*), loài *Sphaerotheca* (ví dụ *Sphaerotheca fuliginea*), loài *Uncinula* (ví dụ *Uncinula necator*);

các bệnh do mầm bệnh rỉ sắt, như loài *Gymnosporangium* (ví dụ *Gymnosporangium sabinae*), loài *Hemileia* (ví dụ *Hemileia vastatrix*), loài *Phakopsora* (ví dụ *Phakopsora pachyrhizi* hoặc *Phakopsora meibomiae*), loài *Puccinia* (ví dụ *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* hoặc *Puccinia striiformis*), loài *Uromyces* (ví dụ *Uromyces appendiculatus*) gây ra;

các bệnh do mầm bệnh từ nhóm Oomycete, như loài *Albugo* (ví dụ *Albugo candida*), loài *Bremia* (ví dụ *Bremia lactucae*), loài *Peronospora* (ví dụ *Peronospora pisi* hoặc *P. brassicae*), loài *Phytophthora* (ví dụ *Phytophthora infestans*), loài *Plasmopara* (ví dụ *Plasmopara viticola*), loài *Pseudoperonospora* (ví dụ *Pseudoperonospora humuli* hoặc *Pseudoperonospora cubensis*), loài *Pythium* (ví dụ *Pythium ultimum*) gây ra;

bệnh đốm lá và bệnh bạc lá do, ví dụ, loài *Alternaria* (ví dụ *Alternaria solani*), loài *Cercospora* (ví dụ *Cercospora beticola*), loài *Cladosporium* (ví dụ *Cladosporium cucumerinum*), loài *Cochliobolus* (ví dụ *Cochliobolus sativus* (dạng bào tử: *Drechslera*, đồng nghĩa với *Helminthosporium*) hoặc *Cochliobolus miyabeanus*), loài *Colletotrichum* (ví dụ *Colletotrichum lindemuthianum*), loài *Xyloconium* (ví dụ *Xyloconium oleaginum*), loài *Diaporthe* (ví dụ *Diaporthe citri*), loài *Elsinoe* (ví dụ *Elsinoe fawcettii*), loài *Gloeosporium* (ví dụ *Gloeosporium laeticolor*), loài *Glomerella* (ví dụ *Glomerella cingulate*), loài *Guignardia* (ví dụ *Guignardia bidwelli*), loài *Leptosphaeria* (ví dụ *Leptosphaeria maculans*), loài *Magnaporthe* (ví dụ *Magnaporthe grisea*), loài *Microdochium* (ví dụ *Microdochium nivale*), loài *Mycosphaerella* (ví dụ *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella* hoặc *Mycosphaerella fijiensis*), loài *Phaeosphaeria* (ví dụ *Phaeosphaeria nodorum*), loài *Pyrenophora* (ví dụ *Pyrenophora teres* hoặc *Pyrenophora tritici repentis*), loài *Ramularia* (ví dụ *Ramularia collo-cygni* hoặc *Ramularia areola*), loài *Rhynchosporium* (ví dụ *Rhynchosporium secalis*), loài *Septoria* (ví dụ *Septoria apii* hoặc *Septoria lycopersici*), loài *Stagonospora* (ví dụ *Stagonospora nodorum*), loài *Typhula* (ví dụ *Typhula incarnate*), loài *Venturia* (ví dụ *Venturia inaequalis*),

các bệnh ở rễ và thân do, ví dụ, loài *Corticium* (ví dụ *Corticium graminarum*), loài *Fusarium* (ví dụ *Fusarium oxysporum*), loài *Gaeumannomyces* (ví dụ *Gaeumannomyces graminis*), loài *Plasmodiophora* (ví dụ *Plasmodiophora brassicae*), loài *Rhizoctonia* (ví dụ *Rhizoctonia solani*), loài *Sarocladium* (ví dụ *Sarocladium oryzae*), loài *Sclerotium*,

(ví dụ *Sclerotium oryzae*), loài *Tapesia*, (ví dụ *Tapesia acuformis*), loài *Thielaviopsis*, (ví dụ *Thielaviopsis basicola*) gây ra;

các bệnh ở tai và chùy (bao gồm lõi ngô) do, ví dụ, loài *Alternaria*, (ví dụ *Alternaria spp.*), loài *Aspergillus* (ví dụ *Aspergillus flavus*), loài *Cladosporium* (ví dụ *Cladosporium cladosporioides*, loài *Claviceps* (ví dụ *Claviceps purpurea*), loài *Fusarium*, (ví dụ *Fusarium culmorum*), loài *Gibberella* (ví dụ *Gibberella zeae*), loài *Monographella*, (ví dụ *Monographella nivalis*), loài *Stagnospora*, (ví dụ *Stagnospora nodorum*) gây ra;

các bệnh do nấm than, ví dụ loài *Sphacelotheca* (ví dụ *Sphacelotheca reiliana*), loài *Tilletia* (ví dụ *Tilletia caries* hoặc *Tilletia controversa*), loài *Urocystis* (ví dụ *Urocystis occulta*), loài *Ustilago* (ví dụ *Ustilago nuda*) gây ra;

bệnh thối quả do, ví dụ, loài *Aspergillus* (ví dụ *Aspergillus flavus*), loài *Botrytis* (ví dụ *Botrytis cinerea*), loài *Penicillium* (ví dụ *Penicillium expansum* hoặc *Penicillium purpurogenum*), loài *Rhizopus* (ví dụ *Rhizopus stolonifer*), loài *Sclerotinia* (ví dụ *Sclerotinia sclerotiorum*), loài *Verticillium* (ví dụ *Verticillium alboatrum*) gây ra;

các bệnh thối và héo từ hạt và từ đất, và cả các bệnh ở cây non do, ví dụ, loài *Alternaria* (ví dụ *Alternaria brassicicola*), loài *Aphanomyces* (ví dụ *Aphanomyces euteiches*), *Ascochyta* (ví dụ *Ascochyta lentis*), loài *Aspergillus* (ví dụ *Aspergillus flavus*), loài *Cladosporium* (ví dụ *Cladosporium herbarum*), loài *Cochliobolus* (ví dụ *Cochliobolus sativus* (dạng bào tử: *Drechslera*, tương đồng *Bipolaris*: *Helminthosporium*)), loài *Colletotrichum* (ví dụ *Colletotrichum coccodes*), loài *Fusarium* (ví dụ *Fusarium culmorum*), loài *Gibberella* (ví dụ *Gibberella zeae*), loài *Macrophomina* (ví dụ *Macrophomina phaseolina*), loài *Microdochium* (ví dụ *Microdochium nivale*), loài *Monographella* (ví dụ *Monographella nivalis*), loài *Penicillium* (ví dụ *Penicillium expansum*), loài *Phoma* (ví dụ *Phoma lingam*), loài *Phomopsis* (ví dụ *Phomopsis sojae*), loài *Phytophthora* (ví dụ *Phytophthora cactorum*), loài *Pyrenophora* (ví dụ *Pyrenophora graminum*), loài *Pyricularia* (ví dụ *Pyricularia oryzae*), loài *Pythium* (ví dụ *Pythium ultimum*), loài *Rhizoctonia* (ví dụ *Rhizoctonia solani*), loài *Rhizopus* (ví dụ *Rhizopus oryzae*), loài *Sclerotium* (ví dụ *Sclerotium rolfsii*), loài *Septoria* (ví dụ *Septoria nodorum*), loài *Typhula* (ví dụ *Typhula incarnate*), loài *Verticillium* (ví dụ *Verticillium dahlia*);

các bệnh ung thư, sần mụn cây và đám cành quái do, ví dụ, loài *Nectria* (ví dụ, *Nectria galligena*) gây ra;

bệnh héo do, ví dụ, loài *Monilinia* (ví dụ, *Monilinia laxa*) gây ra;

bệnh gây biến dạng lá, hoa và quả do, ví dụ, loài *Exobasidium* (ví dụ, *Exobasidium vexans*), loài *Taphrina* (ví dụ, *Taphrina deformans*) gây ra;

bệnh thoái hóa ở thực vật thân gỗ do, ví dụ, loài *Esca* (ví dụ, *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* hoặc *Fomitiporia mediterranea*), loài *Ganoderma* (ví dụ, *Ganoderma boninense*) gây ra;

bệnh ở hoa và hạt do, ví dụ loài *Botrytis* (ví dụ, *Botrytis cinerea*) gây ra;

bệnh ở củ của thực vật do, ví dụ loài *Rhizoctonia* (ví dụ, *Rhizoctonia solani*), loài *Helminthosporium* (ví dụ, *Helminthosporium solani*) gây ra;

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*) gây ra.

Xử lý hạt

Phương pháp phòng trừ các vi sinh vật không mong muốn có thể được sử dụng để bảo vệ hạt khỏi các vi sinh vật gây bệnh thực vật, như nấm.

Thuật ngữ (các) hạt như được sử dụng trong bản mô tả bao gồm hạt ở trạng thái ngủ, hạt đã môi nước, hạt trước khi nhú mầm và hạt với rễ và lá đã nhú.

Do đó, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt và/hoặc cây trồng khỏi các vi sinh vật không mong muốn, như vi khuẩn hoặc nấm, mà bao gồm bước xử lý hạt bằng một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng. Việc xử lý hạt bằng (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng không chỉ bảo vệ hạt khỏi các vi sinh vật gây bệnh thực vật, mà cả cả thực vật nảy mầm, cây non đã nhú lên và thực vật sau khi nhú.

Việc xử lý hạt có thể được thực hiện trước khi gieo, ở thời điểm gieo hoặc một thời gian ngắn sau đó.

Khi việc xử lý hạt được tiến hành trước khi gieo (ví dụ, còn được gọi là các ứng dụng trên hạt), việc xử lý hạt có thể được tiến hành như sau: hạt có thể được đưa vào trong máy trộn với lượng mong muốn của (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa hợp chất này (nguyên dạng hoặc sau khi pha loãng), hạt và (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa hợp chất này được trộn cho tới khi đạt được sự phân bố đồng đều trên hạt. Nếu thích hợp, sau đó hạt có thể được làm khô.

Sáng chế cũng đề cập đến hạt được xử lý bằng một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng. Như nêu trên, việc sử dụng hạt đã xử lý không chỉ cho phép bảo vệ hạt trước và sau khi gieo khỏi các vi sinh vật không mong muốn, như nấm gây bệnh thực vật, mà còn cho phép bảo vệ thực vật nảy mầm và cây non nhú lên từ hạt đã qua xử lý. Phần lớn thương tổn đối với cây trồng do sinh vật có hại gây ra đều bắt nguồn từ sự nhiễm khuẩn của hạt trước khi gieo hoặc sau khi cây nảy mầm. Pha này đặc biệt quan trọng vì rễ và chồi của thực vật đang phát triển đặc biệt nhạy cảm, và ngay cả thương tổn nhỏ cũng có thể gây chết cây.

Do đó, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt và/hoặc cây đang nảy mầm và cây con đã mọc, thông thường hơn là đề cập đến phương pháp bảo vệ cây trồng khỏi các vi sinh vật gây bệnh thực vật, mà bao gồm bước sử dụng hạt đã được xử lý bằng một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng.

Tốt hơn nếu hạt được xử lý ở trạng thái trong đó hạt này đủ ổn định đủ để không xuất hiện bất kỳ tổn hại nào trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ trong khoảng từ lúc thu hoạch đến một thời gian ngắn sau khi gieo. Thường sử dụng hạt đã được tách ra khỏi cây và tách khỏi lõi, vỏ hạt, cuống, vỏ, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt đã được thu hoạch, làm sạch và làm khô đến hàm lượng hơi ẩm nhỏ hơn 15% trọng lượng. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà sau khi sấy khô, ví dụ, đã được xử lý bằng nước và sau đó sấy khô lại, hoặc hạt ngay sau khi phơi nước, hoặc hạt được bảo quản ở điều kiện phơi nước hoặc hạt trước khi nảy mầm, hoặc hạt đã gieo trong khay, băng hoặc giấy ươm hạt.

Lượng (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng được áp dụng cho hạt thường sao cho khả năng nảy mầm của hạt không bị suy yếu, hoặc sao cho thực vật thu được không bị thương tổn. Điều này phải bảo đảm, nhất là trong trường hợp các thành phần hoạt tính có thể thể hiện các tác dụng gây độc thực vật ở các tỷ lệ áp dụng nhất định. Kiểu hình thực chất của thực vật chuyển gen cũng cần được xem xét khi xác định lượng (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng cần áp dụng lên hạt để đạt được mức độ bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm tối ưu với lượng tối thiểu (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng được sử dụng.

Như đã chỉ ra trên đây, các hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng, nguyên như vậy, trực tiếp lên hạt, tức là không sử dụng thành phần bất kỳ khác và không pha loãng, hoặc chế phẩm chứa các hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng. Tốt hơn là các chế phẩm được áp dụng lên hạt ở dạng bất kỳ thích hợp. Ví dụ về các chế phẩm thích hợp bao gồm dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, huyền phù đặc hoặc kết hợp với các chế phẩm bao ngoài khác dùng cho hạt, như vật liệu tạo màng, vật liệu kết viên, bột sắt hoặc kim loại khác mịn, hạt mịn, vật liệu bao ngoài dùng cho hạt đã bắt hoạt và cả các chế phẩm ULV. Các chế phẩm có thể là các sản phẩm sẵn dùng hoặc có thể là các chất cô đặc mà cần phải được pha loãng trước khi dùng.

Các chế phẩm này được điều chế theo cách đã biết, chẳng hạn bằng cách trộn thành phần hoạt tính hoặc hỗn hợp thành phần hoạt tính với các chất phụ gia thông thường, ví dụ, chất độn thông thường và dung môi hoặc chất pha loãng, thuốc nhuộm, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ tương, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất gây lắng thứ cấp, chất dính bám, gibberelin và cả nước.

Các chế phẩm này được điều chế theo cách đã biết, bằng cách trộn các thành phần hoạt tính hoặc hỗn hợp thành phần hoạt tính với chất phụ gia thông thường, ví dụ, chất độn thông thường và cả dung môi hoặc chất pha loãng, thuốc nhuộm, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ tương, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất gây lắng thứ cấp, chất dính bám, gibberelin và cả nước.

Các thuốc nhuộm hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các thuốc nhuộm mà thường dùng cho mục đích như vậy. Có thể sử dụng các chất màu ít tan trong nước hoặc thuốc nhuộm tan trong nước. Ví dụ bao gồm các thuốc nhuộm

đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Màu đỏ chất nhuộm 112 và C.I. Màu đỏ dung môi 1. Các chất làm ướt hữu ích có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất mà thúc đẩy việc làm ướt và thường dùng cho các chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông. Ưu tiên sử dụng các hợp chất alkylnaphtalensulfonat, như diisopropyl- hoặc diisobutylnaphtalensulfonat. Các chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa hữu ích có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng trong chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông. Ưu tiên sử dụng chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp gồm các chất phân tán không ion hoặc anion. Các chất phân tán không ion hữu dụng hợp bao gồm đặc biệt là polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tris(aryl)phenol polyglycol ete và các dẫn xuất được phosphat hoá hoặc sulphat hoá của nó. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là các lignosulfonat, các muối của axit polyacrylic và các chất ngưng tụ arylsulfonat/formaldehyt. Các chất chống tạo bọt mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất ức chế bọt thường dùng cho chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được ưu tiên sử dụng. Các chất bảo quản có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất có thể sử dụng cho mục đích như vậy trong chế phẩm hoá nông. Các ví dụ bao gồm diclophen và hemiformal rượu benzylic. Chất làm đặc thứ cấp mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất có thể sử dụng cho các mục đích như vậy trong chế phẩm hoá nông. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm các dẫn xuất xenluloza, các dẫn xuất axit acrylic, xanthan, các đất sét cải biến và các silic dioxit được chia mịn. Các chất kết dính có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyl và tyloza.

Các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng thích hợp để bảo vệ hạt của giống thực vật bất kỳ mà được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong lâm nghiệp hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn, hạt là hạt ngũ cốc (như lúa mì, đại mạch, hắc mạch, kê, tiểu hắc mạch, và yến mạch), cây cải dầu, ngô, bông, đậu tương, lúa gạo, khoai tây, hướng dương, đậu Hà Lan, cà phê, củ cải (ví dụ củ cải đường và củ cải đường

cho chăn nuôi), lạc, rau (như cà chua, dưa chuột, hành và rau diếp), bãi cỏ và cây cảnh. Đặc biệt có ý nghĩa là việc xử lý hạt lúa mỳ, đậu tương, cây cải dầu, ngô và lúa gạo.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng có thể được sử dụng để xử lý hạt chuyển gen, cụ thể hạt của thực vật có khả năng biểu hiện protein mà hoạt động chống lại sinh vật gây hại, thương tổn do thuốc diệt cỏ gây ra hoặc điều kiện bất lợi phi sinh học, nhờ đó tăng hiệu quả bảo vệ. Tác dụng hiệp đồng bổ sung cũng có thể xảy ra khi tương tác với các chất được tạo thành bằng cách biểu hiện.

Tuyến trùng

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "tuyến trùng" bao gồm tất cả các loài thuộc ngành Nematoda (Giun tròn) và cụ thể ở đây là các loài hoạt động ở dạng ký sinh trên cây hoặc nấm (ví dụ các loài thuộc bộ Aphelenchida, Meloidogyne, Tylenchida và các bộ khác) hoặc cũng như trên người và động vật (ví dụ các loài thuộc bộ Trichinellida, Tylenchida, Rhabditina và Spirurida) và gây hư hại trong hoặc trên các cơ thể sống, và cả các loại giun sán ký sinh khác.

Thuốc diệt tuyến trùng trong bảo vệ thực vật, như được mô tả ở đây, có khả năng kiểm soát tuyến trùng.

Thuật ngữ "kiểm soát tuyến trùng" nghĩa là tiêu diệt các loại tuyến trùng hoặc ngăn ngừa hoặc cản trở sự phát triển của chúng hoặc sự sinh trưởng của chúng hoặc ngăn ngừa hoặc cản trở sự xâm nhập vào bên trong hoặc sự chích hút của chúng trên các mô thực vật.

Ở đây, hiệu quả của các hợp chất được xác định bằng cách so sánh tỷ lệ chết, sự hình thành mụn sần, sự hình thành nang, mật độ tuyến trùng trên mỗi thể tích đất, mật độ tuyến trùng trên mỗi rễ, số lượng trứng tuyến trùng trên mỗi thể tích đất, tính di động của các tuyến trùng giữa cây hoặc bộ phận của cây được xử lý bằng hợp chất có công thức (I) hoặc đất được xử lý và cây hoặc bộ phận của cây chưa được xử lý hoặc đất chưa được xử lý (100%). Tốt hơn là, sự giảm đạt được là 25-50% khi so sánh với cây, bộ phận của cây chưa được xử lý hoặc đất chưa được xử lý, đặc biệt tốt hơn là 51 – 79% và tốt nhất là tiêu diệt hoàn toàn hoặc ngăn chặn hoàn toàn sự phát triển và sinh trưởng của tuyến trùng bởi sự giảm từ 80 đến 100%. Việc kiểm soát tuyến trùng như được mô tả ở

đây cũng bao gồm việc kiểm soát sự tăng sinh của tuyến trùng (sự phát triển nang và/hoặc trứng). Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để giữ cho thực vật hoặc động vật khỏe mạnh, và chúng có thể được sử dụng để cứu chữa, ngăn ngừa hoặc nói chung là để kiểm soát tuyến trùng.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật biết rằng phương pháp để xác định tỷ lệ chết, sự hình thành mụn sần, sự hình thành nang, mật độ tuyến trùng trên mỗi thể tích đất, mật độ tuyến trùng trên mỗi rễ, số lượng trứng của tuyến trùng trên mỗi thể tích đất, tính di động của tuyến trùng.

Sử dụng hợp chất có công thức (I) có thể giữ cho thực vật khỏe mạnh và cũng bao gồm sự giảm thiệt hại do tuyến trùng gây ra và làm tăng năng suất thu hoạch.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "tuyến trùng" để chỉ tuyến trùng thực vật mà bao gồm tất cả các tuyến trùng gây hại cho thực vật. Tuyến trùng thực vật bao gồm tuyến trùng ký sinh trên thực vật và tuyến trùng từ đất. Tuyến trùng ký sinh thực vật bao gồm các loài ký sinh ngoài như *Xiphinema* spp., *Longidorus* spp. và *Trichodorus* spp.; các loài bán ký sinh như *Tylenchulus* spp.; các loài ký sinh trong di trú như *Pratylenchus* spp., *Radopholus* spp. và *Scutellonema* spp.; các loài ký sinh không di trú như *Heterodera* spp., *Globodera* spp. và *Meloidogyne* spp., và cả các loài ký sinh trong trên thân và lá như *Ditylenchus* spp., *Aphelenchoides* spp. và *Hirschmaniella* spp. Các loại tuyến trùng đất ký sinh dễ đặc biệt gây hại là, ví dụ, các tuyến trùng hình thành nang của chi *Heterodera* hoặc *Globodera*, và/hoặc tuyến trùng hình thành mụn sần ở rễ thuộc chi *Meloidogyne*. Các loài gây hại thuộc chi này là, ví dụ, *Meloidogyne incognita*, *Heterodera glycines* (tuyến trùng nang đậu tương), *Globodera pallida* và *Globodera rostochiensis* (tuyến trùng nang khoai tây vàng), các loài này được kiểm soát một cách hiệu quả bằng các hợp chất được mô tả trong sáng chế. Tuy nhiên, việc sử dụng các hợp chất được mô tả trong sáng chế không có nghĩa bị giới hạn ở các chi hoặc loài này, mà cũng mở rộng cho các loại tuyến trùng khác.

Tuyến trùng thực vật bao gồm, ví dụ, *Aglenchus agricola*, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragaria*, và các loài nội ký sinh ở thân và lá *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*,

Bursaphelenchus xylophilus và Bursaphelenchus spp., Cacopaurus pestis, Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax) và Criconemella spp., Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum và Criconemoides spp., Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci, Ditylenchus myceliophagus và cả các loài nội ký sinh ở thân và lá Ditylenchus spp., Dolichodorus heterocephalus, Globodera pallida (=Heterodera pallida), Globodera rostochiensis (giun tròn nang khoai tây vàng), Globodera solanacearum, Globodera tabacum, Globodera virginia và các loài ký sinh trùng tạo nang không di trú Globodera spp., Helicotylenchus digonicus, Helicotylenchus dihystra, Helicotylenchus erythrine, Helicotylenchus multicinctus, Helicotylenchus nannus, Helicotylenchus pseudorobustus và Helicotylenchus spp., Hemicriconemoides, Hemicycliophora arenaria, Hemicycliophora nudata, Hemicycliophora parvana, Heterodera avenae, Heterodera cruciferae, Heterodera glycines (giun tròn nang đậu tương), Heterodera oryzae, Heterodera schachtii, Heterodera zeae và các loài ký sinh tạo nang không di trú Heterodera spp., Hirschmaniella gracilis, Hirschmaniella oryzae, Hirschmaniella spinicaudata và các nội ký sinh trùng ở thân và lá Hirschmaniella spp., Hoplolaimus aegyptii, Hoplolaimus californicus, Hoplolaimus columbus, Hoplolaimus galeatus, Hoplolaimus indicus, Hoplolaimus magnistylus, Hoplolaimus pararobustus, Longidorus africanus, Longidorus breviannulatus, Longidorus elongatus, Longidorus laevicapitatus, Longidorus vineacola và các loài ngoại ký sinh Longidorus spp., Meloidogyne acronea, Meloidogyne africana, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne arenaria thamesi, Meloidogyne artiella, Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne coffeicola, Meloidogyne ethiopica, Meloidogyne exigua, Meloidogyne fallax, Meloidogyne graminicola, Meloidogyne graminis, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne incognita acrita, Meloidogyne javanica, Meloidogyne kikuyensis, Meloidogyne minor, Meloidogyne naasi, Meloidogyne paranaensis, Meloidogyne thamesi và các loài ký sinh trùng không di trú Meloidogyne spp., Meloinema spp., Nacobbus aberrans, Neotylenchus vigissi, Paraphelenchus pseudoparietinus, Paratrachodorus allius, Paratrachodorus lobatus, Paratrachodorus minor, Paratrachodorus nanus, Paratrachodorus porosus, Paratrachodorus teres và Paratrachodorus spp., Paratylenchus hamatus, Paratylenchus minutus, Paratylenchus projectus và Paratylenchus spp., Pratylenchus agilis, Pratylenchus alleni,

Pratylenchus andinus, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus hamatus*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus loosi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus teres*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zae* và các loài nội ký sinh di trú *Pratylenchus* spp., *Pseudohalenchus minutus*, *Psilenchus magnidens*, *Psilenchus tumidus*, *Punctodera chalcensis*, *Quinisulcius acutus*, *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, các loài ngoại ký sinh di trú *Radopholus* spp., *Rotylenchulus borealis*, *Rotylenchulus parvus*, *Rotylenchulus reniformis* và *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus laurentinus*, *Rotylenchus macrodoratus*, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus uniformis* và *Rotylenchus* spp., *Scutellonema brachyurum*, *Scutellonema bradys*, *Scutellonema clathricaudatum* và các loài nội ký sinh di trú *Scutellonema* spp., *Subanguina radiciola*, *Tetylenchus nicotianae*, *Trichodorus cylindricus*, *Trichodorus minor*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus proximus*, *Trichodorus similis*, *Trichodorus sparsus* và các loài ngoại ký sinh *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus agri*, *Tylenchorhynchus brassicae*, *Tylenchorhynchus clarus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus digitatus*, *Tylenchorhynchus ebriensis*, *Tylenchorhynchus maximus*, *Tylenchorhynchus nudus*, *Tylenchorhynchus vulgaris* và *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus semipenetrans* và các loài bán ký sinh *Tylenchulus* spp., *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema dimorphicaudatum*, *Xiphinema index* và các loài ngoại ký sinh *Xiphinema* spp.

Tuyến trùng để kiểm soát mà hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng cho bao gồm tuyến trùng thuộc chi *Meloidogyne* như tuyến trùng gây sần rễ miền Nam (*Meloidogyne incognita*), tuyến trùng gây sần rễ vùng Java (*Meloidogyne javanica*), tuyến trùng gây sần rễ miền Bắc (*Meloidogyne hapla*) và tuyến trùng gây sần rễ lạc (*Meloidogyne arenaria*); tuyến trùng thuộc chi *Ditylenchus* như tuyến trùng gây thối khoai tây (*Ditylenchus destructor*) và giun tròn hại thân và củ (*Ditylenchus dipsaci*); tuyến trùng thuộc chi *Pratylenchus* như tuyến trùng làm tổn thương rễ cây phi (*Pratylenchus penetrans*), tuyến trùng làm tổn thương rễ cây hoa cúc (*Pratylenchus fallax*), tuyến trùng rễ cà phê (*Pratylenchus coffeae*), tuyến trùng rễ chè (*Pratylenchus loosi*) và tuyến trùng rễ óc chó (*Pratylenchus vulnus*); tuyến trùng thuộc chi *Globodera*

như tuyến trùng nang khoai tây vàng (*Globodera rostochiensis*) và tuyến trùng nang khoai tây trắng (*Globodera pallida*); tuyến trùng thuộc chi *Heterodera* như tuyến trùng nang đậu tương (*Heterodera glycines*) và giun tròn nang củ cải đường (*Heterodera schachtii*); tuyến trùng thuộc chi *Aphelenchoides* như tuyến trùng đầu trắng lúa (*Aphelenchoides besseyi*), tuyến trùng trên hoa cúc (*Aphelenchoides ritzemabosi*) và tuyến trùng trên dâu tây (*Aphelenchoides fragariae*); tuyến trùng thuộc chi *Aphelenchus* như tuyến trùng ăn nấm (*Aphelenchus avenae*); tuyến trùng thuộc chi *Radopholus*, như tuyến trùng đào hang (*Radopholus similis*); tuyến trùng thuộc chi *Tylenchulus* như tuyến trùng trên rễ cây có múi (*Tylenchulus semipenetrans*); tuyến trùng thuộc chi *Rotylenchulus* như tuyến trùng dạng thận (*Rotylenchulus reniformis*); tuyến trùng ở trên cây như tuyến trùng gỗ thông (*Bursaphelenchus xylophilus*) và tuyến trùng vòng đỏ (*Bursaphelenchus cocophilus*) và các loại tương tự.

Thực vật để bảo vệ mà hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng bao gồm thực vật như ngũ cốc (ví dụ lúa, lúa mạch, lúa mì, mạch đen, yến mạch, ngô và loại tương tự), đậu (đậu tương, đậu aduki, đậu trạch, đậu răng ngựa, đậu Hà Lan, lạc và loại tương tự), cây ăn quả/quả (táo, các loài cây có múi, lê, nho, đào, mơ Nhật, anh đào, óc chó, hạnh nhân, chuối, dâu tây và loại tương tự), các loài rau (cải bắp, cà chua, rau bina, bông cải xanh, rau diếp, hành, hành tươi, tiêu và loại tương tự), cây ăn củ (cà rốt, khoai tây, khoai lang, củ cải cay, củ sen, củ cải và loại tương tự), thực vật làm nguyên liệu thô cho công nghiệp (bông, gai dầu, cây dướng, cây mitsumata, cây cải dầu, cây củ cải đường, cây hoa bia, cây mía đường, cây củ cải, cây ô liu, cây cao su, cây cọ, cây cà phê, cây thuốc lá, cây chè và loại tương tự), cây họ bầu bí (bí đỏ, dưa chuột, dưa hấu, dưa lưới và loại tương tự), thực vật đồng cỏ (cỏ chân gà, cây cao lương, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng và loại tương tự), cỏ thảm (cỏ mascarene, cỏ bentgrass và loại tương tự), thực vật làm gia vị, v.v. (cây oải hương, cây hương thảo, cỏ xạ hương, rau mùi tây, hồ tiêu, gừng và loại tương tự) và cây hóa (hoa cúc, hoa hồng, cây phong lan và loại tương tự).

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây cà phê, cụ thể là *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne coffeicola*, *Helicotylenchus* spp. và cả

Meloidogyne paranaensis, *Rotylenchus* spp., *Xiphinema* spp., *Tylenchorhynchus* spp. và *Scutellonema* spp..

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên khoai tây, cụ thể là *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus coffeae*, *Ditylenchus dipsaci* và của *Pratylenchus allenii*, *Pratylenchus andinus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus loosi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus teres*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Trichodorus cylindricus*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus proximus*, *Trichodorus similis*, *Trichodorus sparsus*, *Paratrichodorus minor*, *Paratrichodorus allius*, *Paratrichodorus nanus*, *Paratrichodorus teres*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne thamesi*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne javanica*, *Nacobbus aberrans*, *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Ditylenchus destructor*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus reniformis*, *Neotylenchus vigissi*, *Paraphelenchus pseudoparietinus*, *Aphelenchoides fragariae* và *Meloinema* spp.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cà chua, cụ thể là *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus penetrans* và cả *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, *Paratrichodorus minor*, *Meloidogyne exigua*, *Nacobbus aberrans*, *Globodera solanacearum*, *Dolichodorus heterocephalus* và *Rotylenchulus reniformis*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây dưa chuột, cụ thể là *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Rotylenchulus reniformis* và *Pratylenchus thornei*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây bông, cụ thể là *Belonolaimus longicaudatus*, *Meloidogyne incognita*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* và *Rotylenchulus reniformis*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây ngô, cụ thể là *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor* và cả *Pratylenchus*

brachyurus, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus zae*, (*Belonolaimus gracilis*), *Belonolaimus nortoni*, *Longidorus breviannulatus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne arenaria thamesi*, *Meloidogyne graminis*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne naasi*, *Heterodera avenae*, *Heterodera oryzae*, *Heterodera zae*, *Punctodera chaltoensis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Hoplolaimus aegyptii*, *Hoplolaimus magnistylus*, *Hoplolaimus galeatus*, *Hoplolaimus indicus*, *Helicotylenchus digonicus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus pseudorobustus*, *Xiphinema americanum*, *Dolichodorus heterocephalus*, *Criconemella ornata*, *Criconemella onoensis*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus borealis*, *Rotylenchulus parvus*, *Tylenchorhynchus agri*, *Tylenchorhynchus clarus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus maximus*, *Tylenchorhynchus nudus*, *Tylenchorhynchus vulgaris*, *Quinisulcius acutus*, *Paratylenchus minutus*, *Hemicycliophora parvana*, *Aglenchus agricola*, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides arachidis*, *Scutellonema brachyurum* và *Subanguina radiciola*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây đậu tương, cụ thể là *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus scribneri*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Heterodera glycines*, *Hoplolaimus columbus* và cả *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus allenii*, *Pratylenchus agilis*, *Pratylenchus zae*, *Pratylenchus vulnus*, (*Belonolaimus gracilis*), *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne hapla*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* và *Rotylenchulus reniformis*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây thuốc lá, cụ thể là *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* và cả *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zae*, *Longidorus elongatus*, *Paratrichodorus lobatus*, *Trichodorus* spp., *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Globodera tabacum*, *Globodera solanacearum*, *Globodera virginiae*, *Ditylenchus dipsaci*, *Rotylenchus* spp., *Helicotylenchus* spp., *Xiphinema americanum*, *Criconemella* spp., *Rotylenchulus reniformis*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus* spp. và *Tetylenchus nicotianae*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây có múi, cụ thể là *Pratylenchus coffeae* và cả *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus vulnus*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor*, *Paratrichodorus porosus*, *Trichodorus*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Rotylenchus macrodorus*, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema index*, *Criconemella* spp., *Hemicriconemoides*, *Radopholus similis* và *Radopholus citrophilus*, *Hemicycliophora arenaria*, *Hemicycliophora nudata* và *Tylenchulus semipenetrans*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây chuối, cụ thể là *Pratylenchus coffeae*, *Radopholus similis* và cả *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus loosi*, *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus dihystra* và *Rotylenchulus* spp..

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây dứa, cụ thể là *Pratylenchus zae*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Meloidogyne* spp., *Rotylenchulus reniformis* và cả *Longidorus elongatus*, *Longidorus laeviscapitatus*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus minor*, *Heterodera* spp., *Ditylenchus myceliophagus*, *Hoplolaimus californicus*, *Hoplolaimus pararobustus*, *Hoplolaimus indicus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus nannus*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus erythrae*, *Xiphinema dimorphicaudatum*, *Radopholus similis*, *Tylenchorhynchus digitatus*, *Tylenchorhynchus ebriensis*, *Paratylenchus minutus*, *Scutellonema clathricaudatum*, *Scutellonema bradys*, *Psilenchus tumidus*, *Psilenchus magnidens*, *Pseudohalenchus minutus*, *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense* và *Criconemoides ornatum*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng trên cây nho, cụ thể là *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema index* và cả *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus thornei* và *Tylenchulus semipenetrans*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng ở cây thân gỗ - quả dạng táo, cụ thể là *Pratylenchus penetrans* và cả *Pratylenchus vulnus*, *Longidorus elongatus*, *Meloidogyne incognita* và *Meloidogyne hapla*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng ở cây thân gỗ - quả dạng quả hạch, cụ thể là *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Crictonemella xenoplax* và của *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus zeae*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Xiphinema americanum*, *Crictonemella curvata*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus hamatus*, *Paratylenchus projectus*, *Scutellonema brachyurum* và *Hoplolaimus galeatus*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để kiểm soát tuyến trùng ở cây thân gỗ, cây mía đường và cây lúa, cụ thể là *Trichodorus* spp., *Crictonemella* spp. và cả *Pratylenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Aphelenchoides* spp., *Heterodera* spp., *Xiphinema* spp. và *Cacopaurus pestis*.

Ứng dụng

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng ở dạng nguyên như vậy, hoặc ví dụ ở dạng dung dịch dùng ngay, nhũ tương, huyền phù nền nước hoặc dầu, bột, bột thấm ướt, hồ, bột hòa tan, bụi, hạt mịn hòa tan, hạt mịn để phát tán, huyền phù nhũ tương thể đặc, các sản phẩm tự nhiên được tẩm hợp chất có công thức (I), các chất tổng hợp được tẩm hợp chất có công thức (I), phân bón hoặc các vi nang trong các chất polyme.

Việc ứng dụng được thực hiện theo cách thông thường, ví dụ bằng cách tưới nước, phun, phun sương, phát tán, rắc bụi, tạo bột, rải và tương tự. Cũng có thể triển khai hợp chất có công thức (I) bằng phương pháp thể tích cực thấp, thông qua hệ thống tưới nhỏ giọt hoặc áp dụng tưới ướt, để áp dụng lên luống gieo hoặc phun lên cuống hoặc thân trong đất. Ngoài ra, có thể áp dụng hợp chất có công thức (I) nhờ phương tiện làm kín vết thương, sơn hoặc băng vết thương khác.

Lượng hữu hiệu và tương thích với thực vật của hợp chất có công thức (I) mà được áp dụng cho cây, các bộ phận của cây, quả, hạt hoặc đất sẽ tùy thuộc vào các yếu tố khác nhau, như hợp chất/chế phẩm được sử dụng, đối tượng xử lý (thực vật, bộ phận của thực vật, quả, hạt hoặc đất), kiểu xử lý (phun bụi, phun, băng hạt), mục đích xử lý (chữa trị và bảo vệ), loại vi sinh vật, giai đoạn phát triển của các vi sinh vật, độ nhạy của các vi sinh vật, giai đoạn phát triển của cây trồng và các điều kiện môi trường.

Khi hợp chất có công thức (I) được sử dụng làm chất diệt nấm, tỷ lệ áp dụng có thể thay đổi trong phạm vi tương đối rộng, tùy thuộc vào loại ứng dụng. Để xử lý các bộ phận của cây, như lá, tỷ lệ áp dụng có thể nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10000 g/ha, tốt hơn từ 10 đến 1000 g/ha, tốt hơn nữa từ 50 đến 300 g/ha (trong trường hợp ứng dụng bằng cách tưới nước hoặc nhỏ giọt, thậm chí có thể giảm tỷ lệ áp dụng, đặc biệt là khi sử dụng các nền trơ như bông khoáng hoặc peclit). Để xử lý hạt, tỷ lệ áp dụng có thể nằm trong khoảng từ 0,1 đến 200 g trên 100 kg hạt, tốt hơn từ 1 đến 150 g trên 100 kg hạt, tốt hơn nữa từ 2,5 đến 25 g trên 100 kg hạt, thậm chí tốt hơn nữa từ 2,5 đến 12,5 g trên 100 kg hạt. Để xử lý đất, tỷ lệ áp dụng có thể nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10000 g/ha, tốt hơn từ 1 đến 5000 g/ha.

Các tỷ lệ áp dụng này chỉ là ví dụ minh họa và không dự định giới hạn phạm vi bảo hộ của sáng chế.

Bảo vệ vật liệu

Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng có thể được sử dụng trong bảo vệ vật liệu, đặc biệt là trong bảo vệ vật liệu công nghiệp chống lại sự tấn công và phá hủy của vi sinh vật không mong muốn.

Ngoài ra, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng làm chế phẩm chống rỉ sét, riêng biệt hoặc kết hợp với các thành phần hoạt tính khác.

Các vật liệu công nghiệp theo ngữ cảnh của sáng chế được hiểu có nghĩa là các vật liệu vô tri vô giác mà đã được tạo ra để sử dụng trong công nghiệp. Ví dụ, vật liệu công nghiệp mà cần được bảo vệ tránh khỏi sự biến đổi hoặc phá hủy bởi vi khuẩn có

thể là chất kết dính, keo dán, giấy, giấy dán tường và bìa cứng, hàng dệt, thảm, da, gỗ, sợi và giấy mỏng, sơn và các vật phẩm bằng chất dẻo, các vật liệu bôi trơn làm mát và các vật liệu khác mà chúng có thể bị nhiễm hoặc bị phá hủy bởi vi sinh vật. Các bộ phận của nhà máy sản xuất và các tòa nhà, ví dụ, các đường nước làm lạnh, các hệ thống làm lạnh và gia nhiệt và các bộ phận thông gió và điều hòa không khí, mà các bộ phận này có thể bị tổn hại bởi sự tăng sinh của các vi sinh vật cũng có thể được kể tới trong phạm vi các vật liệu cần được bảo vệ. Vật liệu công nghiệp trong phạm vi của sáng chế tốt hơn bao gồm chất kết dính, hồ dán, giấy và thể, da, gỗ, sơn, vật liệu bôi trơn làm mát và các dịch truyền nhiệt, tốt hơn là gỗ.

Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể phòng tránh được các tác dụng phụ, như gây thối, mục, phai màu, mất màu hoặc hình thành mốc.

Trong trường hợp xử lý gỗ, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng có thể được sử dụng chống lại bệnh do nấm sinh trưởng ở trên hoặc bên trong thân gỗ.

Thân gỗ có nghĩa là tất cả các loại gỗ và tất cả các loại gia công từ gỗ này dự định trong xây dựng, ví dụ, gỗ đặc, gỗ tỷ trọng cao, gỗ lát và gỗ dán. Ngoài ra, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng để bảo vệ các đối tượng mà tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là thân tàu thủy, sàn, lưới, tòa nhà, nơi neo đậu tàu và các hệ thống truyền tín hiệu, chống lại sự đóng cặn.

Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng có thể được sử dụng để bảo vệ hàng hóa lưu kho. Hàng hóa lưu kho được hiểu có nghĩa là các chất tự nhiên có nguồn gốc từ thực vật hoặc động vật hoặc các sản phẩm chế biến từ các loại này có nguồn gốc từ nhiên và mong muốn cần được bảo vệ trong thời gian dài. Hàng hóa lưu kho có nguồn gốc thực vật, ví dụ, cây hoặc các bộ phận của cây, như thân, lá, thân củ, hạt, quả, hột, có thể được bảo vệ ngay khi thu hoạch hoặc sau khi xử lý bằng cách sấy khô (sơ bộ), tạo ẩm, tán, nghiền, ép hoặc rang. Hàng hóa lưu kho cũng bao gồm thân gỗ, cả chưa xử lý như gỗ xây dựng, cột điện và hàng rào hoặc ở dạng thành phẩm, như đồ đặc. Hàng hóa lưu kho có nguồn gốc từ động vật là, ví dụ, da sống, da thuộc, lông và tóc. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể phòng tránh được các tác dụng phụ, như gây thối, mục, phai màu, mất màu hoặc hình thành mốc.

Vi sinh vật mà có khả năng làm thoái biến hoặc làm thay đổi vật liệu công nghiệp bao gồm, ví dụ, vi khuẩn, nấm, nấm men, tảo và các sinh vật tạo nhọt. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế tốt hơn là hoạt động chống lại nấm, đặc biệt là mốc, nấm làm phai màu gỗ và nấm phá hủy gỗ (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* và *Zygomycetes*), và chống lại các sinh vật tạo nhọt và tảo. Ví dụ bao gồm các vi sinh vật thuộc các chi sau: *Alternaria*, như *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, như *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, như *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, như *Coniophora puetana*; *Lentinus*, như *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, như *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, như *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, như *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, như *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, như *Trichoderma viride*; *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* và *Tyromyces spp.*, *Cladosporium spp.*, *Paecilomyces spp.* *Mucor spp.*, *Escherichia*, như *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, như *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, như *Staphylococcus aureus*, *Candida spp.* và *Saccharomyces spp.*, như *Saccharomyces cerevisiae*.

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

Ví dụ điều chế 1: etyl 1-{[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất I.03)

Bước 1: Điều chế metyl 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylat

1,35 g (5,04 mmol) metyl 3-axetamido-4,5-diclothiophen-2-carboxylat được hòa tan trong hỗn hợp của 2,1 mL (25,18 mmol) của dung dịch axit hydrocloric nước 37% (khối lượng/khối lượng) và 8,2 mL metanol. Hỗn hợp này được gia nhiệt tại 75°C trong 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng đã được làm nguội được xử lý với dung dịch natri hydroxit 30% (khối lượng/khối lượng) tại 0°C. Dung dịch thu được được chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfate, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm để tạo ra 812 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 70%) metyl 3-amino-4,5-

diclothiophen-2-carboxylat dưới dạng chất rắn màu nâu được sử dụng nguyên như vậy ở bước tiếp theo. $\text{LogP} = 3,11$. $(\text{M}+\text{H}) = 226$.

Bước 2: Điều chế metyl 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylat (hợp chất IIa.03)

Dung dịch của 763 mg (3,41 mmol) đồng bromua (II) và 0,53 mL (độ tinh khiết 90%, 3,99 mmol) của *tert*-butyl nitrit trong 10,5 mL của axetonitril khan được bổ sung theo phần 600 mg (độ tinh khiết 88%, 2,33 mmol) metyl 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylat tại 0°C. Sau khi khí được sinh ra, dung dịch được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với etyl axetat và được axit hóa bằng dung dịch axit hydrocloric nước 1 M. Lớp nước được chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/etyl axetat) để thu được 563 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 82%) metyl 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylat ở dạng chất rắn màu vàng. $\text{LogP} = 3,99$. $(\text{M}+\text{H}) = 288$.

Bước 3: Điều chế axit 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylic (hợp chất IIa.04)

Dung dịch của 250 mg (0,86 mmol) metyl 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylat trong 5 mL tetrahydrofuran được bổ sung theo giọt 1 mL dung dịch kali hydroxit nước 1,9 M (1,9 mmol). Phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 18 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. Các lớp nước kết hợp được axit hóa cẩn thận bằng dung dịch axit hydrocloric nước 37% (khối lượng/khối lượng) tại 0°C và được chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm để tạo ra 219 mg (độ tinh khiết 96%, hiệu suất 88%) axit 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylic dưới dạng chất rắn màu trắng. $\text{LogP} = 2,51$. $(\text{M}-\text{H}) = 273$.

Bước 4: Điều chế etyl 1-{[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất I.03)

Trong bình đáy tròn 100 mL dưới khí quyển trơ, dung dịch của 2,47 g (14,6 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolidinium clorua được hòa tan trong 50 mL diclometan được bổ sung qua dung dịch của 3,45 g (độ tinh khiết 90%, 11,2 mmol) của

axit 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylic và 8,43 mL (48,3 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin được hòa tan trong 50 mL diclometan. Sau 5 phút khuấy, 2,47 mg (14,6 mmol) etyl 1-aminoxyclopropancarboxylat hydroclorua (1:1) được bổ sung và hỗn hợp phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm và cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/etyl axetat) để thu được 3,75 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 86%) etyl 1-[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropancarboxylat ở dạng chất rắn màu be. LogP = 3,44. (M+H) = 386.

Ví dụ điều chế 2: Axit 1-[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropancarboxylic (hợp chất I.15)

Dung dịch của 150 mg (0,38 mmol) etyl 1-[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropancarboxylat trong 2,3 mL tetrahydrofuran được bổ sung theo giọt dung dịch của 19,5 mg (0,81 mmol) lithi hydroxit trong nước (0,4 mL). Phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng với etyl axetat, nước và được axit hóa cẩn thận đến độ pH 1 với dung dịch axit hydrocloric nước 1 M và được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm để tạo ra 131 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 94%) axit 3-bromo-4,5-diclothiophen-2-carboxylic dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,39. (M-H) = 358.

Ví dụ điều chế 3: etyl 1-[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropancarboxylat (hợp chất I.03)

Bước 1: Điều chế axit 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylic (hợp chất XIIIa.02)

Dung dịch của 200 mg (0,74 mmol) metyl 3-axetamido-4,5-diclothiophen-2-carboxylat trong 1,0 mL metanol được bổ sung theo giọt dung dịch của 105 mg (1,86 mmol) kali hydroxit trong nước (1,0 mL). Phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 0,5 giờ sau đó được gia nhiệt tại 85°C trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng tạo thành

được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được lớp nước mà được axit hóa một cách cẩn thận đến độ pH 6 bằng dung dịch axit hydrochloric nước 1 M. Chất kết tủa thu được được lọc ra và được làm khô để thu được 112 mg (độ tinh khiết 96%, hiệu suất 68%) hợp chất tiêu đề ở dạng chất rắn màu be. $\text{LogP} = 2,05$. $(\text{M}+\text{H}) = 212$.

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

Dung dịch của 150 mg (0,60 mmol) axit 3-amino-4,5-diclothiophen-2-carboxylic hydroclorua (1:1) và 255 mg (1,50 mmol) etyl 1-aminoxyclopropanecarboxylat 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 của 255 mg (1,50 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolium clorua trong 2,0 mL diclometan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng này được dừng bằng nước và được chiết bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng sắc ký lỏng hiệu năng cao điều chế (gradien axetonitril/dung dịch nước của axit formic (1%)) để thu được 69 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 35%) hợp chất tiêu đề ở dạng chất rắn màu trắng. $\text{LogP} = 2,77$. $(\text{M}+\text{H}) = 323$.

Bước 3: Điều chế etyl 1-{[(3-bromo-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất I.03)

Dung dịch của 53 mg (0,46 mmol) đồng bromua (II) và 61 μL (độ tinh khiết 90%, 0,46 mmol) *tert*-butyl nitrit trong 2 mL axetonitril khan được bổ sung theo giọt dung dịch của 100 mg (0,30 mmol) etyl 1-{[(3-amino-4,5-diclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat trong 2 mL axetonitril khan tại 0°C. Sau khi khí được sinh ra, dung dịch được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 72 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng diclometan và được axit hóa bằng dung dịch axit hydrochloric nước 1 M. Lớp nước được chiết hai lần bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô đặc trong áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng sắc ký lỏng hiệu năng cao điều chế (gradien axetonitril/dung dịch nước của axit formic (1%)) sau đó bằng sắc ký lỏng siêu tới hạn điều chế (gradien

CO₂/etanol) để thu được 30 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 25%) hợp chất tiêu đề ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 3,48. (M+H) = 386.

Ví dụ điều chế 4: etyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất I.01)

Bước 1: Điều chế etyl 1-{[(4-bromo-3-flo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất IVa.01)

Dung dịch của 300 mg (1,33 mmol) axit 4-bromo-3-flothiophen-2-carboxylic và 442 mg (2,66 mmol) etyl 1-aminoxyclopropanecarboxylat hydroclorua (1:1) được hòa tan trong 10 mL diclometan được bổ sung 1,0 mL (5,73 mmol) N,N-diisopropyletylamin sau đó là dung dịch của 293 mg (1,73 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolinium clorua trong 1,7 mL diclometan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy tại nhiệt độ phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng này được dùng bằng nước và được chiết bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và được cô đặc trong áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/etyl axetat) để thu được 315 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 70%) hợp chất tiêu đề ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,39. (M+H) = 336.

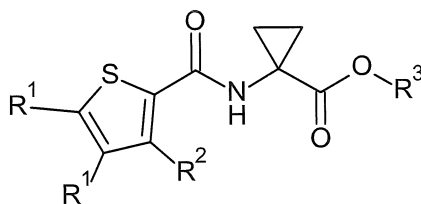
Bước 2: Điều chế etyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat (hợp chất I.01)

Trong lọ vi sóng, huyền phù có khuấy của 100 mg (0,29 mmol) etyl 1-{[(4-bromo-3-flo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat trong 1 mL axit axetic được bổ sung 92 µL (1,78 mmol) brom. Lọ này được bịt kín và hỗn hợp phản ứng được khuấy tại 70°C trong 2,5 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm nguội đến nhiệt độ phòng và được bổ sung vào dung dịch được khuấy của đá và natri thiosulfat. Hỗn hợp thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước, được làm khô qua natri sulfat, được lọc và được cô trong điều kiện áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/etyl axetat) để thu được 27 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 22%) hợp chất tiêu đề ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 3,13. (M+Na) = 436.

Các hợp chất minh họa

Các hợp chất làm ví dụ theo sáng chế như được thể hiện trong các bảng 1, 2, 3, 4, 5 và 6 được điều chế tương tự với các ví dụ được đưa ra trên đây và/hoặc theo mô tả chung của các quy trình được bộc lộ ở đây.

Bảng 1 sau đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về các hợp chất có công thức (I).



(I)

Bảng 1:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.01	Br	F	Et	3,13 ^[a]
I.02	Br	F	H	2,19 ^[a]
I.03	Cl	Br	Et	3,45 ^[a]
I.04	Cl	I	Et	3,39 ^[a]
I.05	Cl	I	H	2,34 ^[a]
I.06	Br	I	Et	3,41 ^[a]
I.07	Br	I	Me	3,06 ^[a]
I.08	Br	I	H	2,43 ^[a]
I.09	Br	Cl	Et	3,51 ^[a]
I.10	Br	Cl	Me	3,06 ^[a]
I.11	Br	Br	Me	3,11 ^[a]
I.12	Cl	Br	Me	3,06 ^[a]
I.13	Br	Cl	H	2,41 ^[a]
I.14	Br	Br	H	2,43 ^[a]
I.15	Cl	Br	H	2,37 ^[a]
I.16	Br	F	Me	2,77 ^[a]
I.17	Br	F	benzyl	3,94 ^[a]
I.18	Br	F	cyclopentyl	3,99 ^[a]
I.19	Br	F	tert-butyl	3,91 ^[a]
I.20	Br	F	2-methylpropyl	3,92 ^[a]
I.21	Br	F	butyl	3,96 ^[a]
I.22	Br	F	isopropyl	3,52 ^[a]

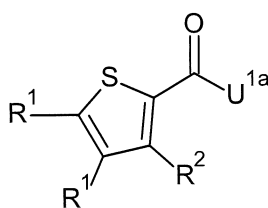
Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.23	Br	F	prop-2-yn-1-yl	3,06 ^[a]
I.24	Br	F	alyl	3,33 ^[a]
I.25	Cl	Br	benzyl	4,28 ^[a]
I.26	Cl	Br	xyclopentyl	4,37 ^[a]
I.27	Cl	Br	tert-butyl	4,30 ^[a]
I.28	Cl	Br	2-metylpropyl	4,31 ^[a]
I.29	Cl	Br	butyl	4,34 ^[a]
I.30	Cl	Br	xyclobutyl	4,07 ^[a]
I.31	Cl	Br	propyl	3,89 ^[a]
I.32	Cl	Br	isopropyl	3,86 ^[a]
I.33	Cl	Br	prop-2-yn-1-yl	3,35 ^[a]
I.34	Cl	Br	alyl	3,66 ^[a]
I.35	Br	I	xyclobutyl	3,99 ^[a]
I.36	Br	F	xyclobutyl	3,71 ^[a]
I.37	Br	F	propyl	3,54 ^[a]
I.38	Br	Br	xyclobutyl	4,10 ^[a]
I.39	Br	Br	propyl	3,92 ^[a]
I.40	Br	Cl	propyl	3,91 ^[a]
I.41	Br	I	propyl	3,85 ^[a]
I.42	Br	Cl	xyclobutyl	4,17 ^[a]
I.43	Br	Br	Et	3,51 ^[a]
I.44	Cl	F	Et	3,05 ^[a]
I.45	Cl	F	Me	2,65 ^[a]
I.46	Cl	Br	xyclopropylmetyl	4,05 ^[a]
I.47	Br	Br	prop-2-yn-1-yl	3,44 ^[a]
I.48	Br	Br	alyl	3,77 ^[a]
I.49	Br	Br	tert-butyl	4,40 ^[a]
I.50	Br	Br	benzyl	4,37 ^[a]
I.51	Br	I	prop-2-yn-1-yl	3,40 ^[a]
I.52	Br	I	alyl	3,71 ^[a]
I.53	Br	I	tert-butyl	4,30 ^[a]
I.54	Br	I	benzyl	4,30 ^[a]
I.55	Br	Br	xyclopentyl	4,47 ^[a]
I.56	Br	Br	2-metylpropyl	4,40 ^[a]
I.57	Br	Br	butyl	4,44 ^[a]
I.58	Br	Br	isopropyl	3,98 ^[a]
I.59	Br	I	xyclopentyl	4,37 ^[a]
I.60	Br	I	2-metylpropyl	4,33 ^[a]
I.61	Br	I	butyl	4,33 ^[a]

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.62	Br	I	isopropyl	3,87 ^[a]
I.63	Cl	Br	xyanometyl	3,06 ^[a]
I.64	Cl	Br	2,2,2-trifloetyl	3,91 ^[a]
I.65	Cl	Br	trimetylsilylmetyl	5,00 ^[a]
I.66	Cl	Br	phenyl	4,19 ^[a]
I.67	Br	Br	xyclopropylmetyl	4,02 ^[a]
I.68	Br	Br	oxan-4-yl	3,26 ^[a]
I.69	Br	Br	trimetylsilylmetyl	4,97 ^[a]
I.70	Cl	Br	oxan-4-yl	3,23 ^[a]
I.71	Cl	Br	thietan-3-yl	3,87 ^[a]
I.72	Br	Br	xyanometyl	3,16 ^[a]
I.73	Br	Br	phenyl	4,23 ^[a]
I.74	Br	Br	2,2,2-trifloetyl	3,94 ^[a]
I.75	Br	Br	thietan-3-yl	4,85 ^[a]

Lưu ý: Me: metyl, Et: etyl

Các chất trung gian làm ví dụ theo sáng chế như được thể hiện trong các bảng sau đây được điều chế tương tự như các ví dụ được đưa ra trên đây và/hoặc theo mô tả chung về các quy trình được bộc lộ ở đây.

Bảng 2 sau đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về các chất trung gian có công thức (IIa).



(IIa)

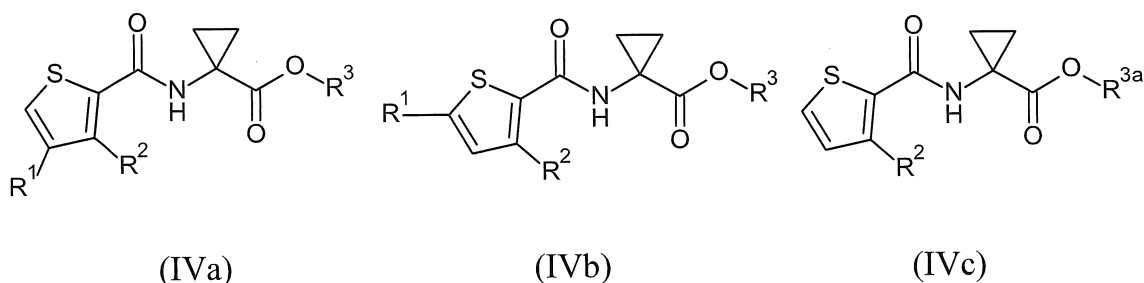
Bảng 2:

Ví dụ số	R ¹	R ²	U ^{1a}	LogP
II.a.01	Br	F	2-metylpropoxy	5,31 ^[a]
II.a.02	Cl	I	OEt	4,73 ^[b]
II.a.03	Cl	Br	OMe	4,11 ^[a]

Ví dụ số	R ¹	R ²	U ^{1a}	LogP
II.a.04	Cl	Br	OH	2,52 ^[a]
II.a.05	Br	I	OMe	4,20 ^[a]
II.a.06	Cl	I	OMe	4,15 ^[a]
II.a.07	Cl	I	OH	2,64 ^[a]
II.a.08	Br	I	OEt	4,78 ^[a]
II.a.09	Cl	Br	OEt	4,58 ^[a]

Lưu ý: Me: metyl, Et: etyl

Bảng 3 sau đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về các chất trung gian có công thức (IVa), (IVb) và (IVc).

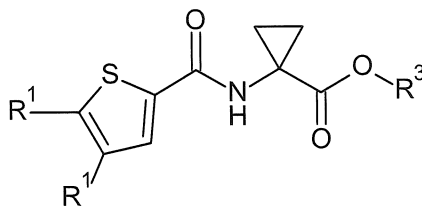


Bảng 3:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ^{3a}	LogP
IVa.01	Br	F	Et	-	2,37 ^[a]
IVb.01	Br	Cl	Et	-	2,84 ^[a]
IVb.02	Br	I	Et	-	2,98 ^[a]
IVb.03	Br	F	Et	-	2,46 ^[a]
IVb.04	Cl	Br	Et	-	2,86 ^[a]
IVb.05	Br	Br	Et	-	2,92 ^[a]
IVc.01	-	F	-	Et	1,65 ^[a]

Lưu ý: Et: etyl

Bảng 4 sau đây minh họa theo các không giới hạn các ví dụ về các chất trung gian có công thức (V).



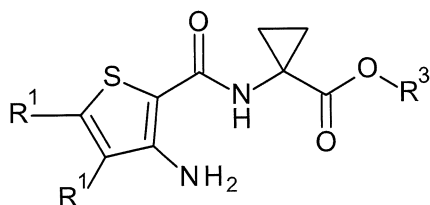
(V)

Bảng 4:

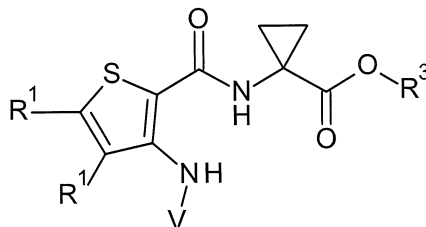
Ví dụ số	R¹	R³	LogP
V.01	Br	Et	2,90 ^[a]
V.02	Br	isopropyl	3,25 ^[a]
V.03	Cl	Et	2,77 ^[a]
V.04	Cl	Me	2,49 ^[a]
V.05	Cl	H	2,01 ^[a]

Lưu ý: Me: metyl, Et: etyl

Bảng 5 sau đây minh họa theo cách không giới hạn các ví dụ về các chất trung gian có công thức (XI) và (XIIa).



(XI)



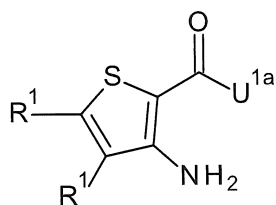
(XIIa)

Bảng 5:

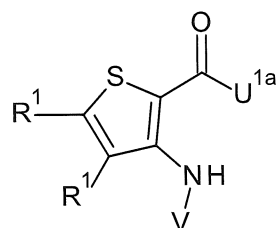
Ví dụ số	R¹	R³	V	LogP
XI.01	Cl	Et		2,77 ^[a]
XIIa.01	Cl	Et	<i>tert</i> -butoxycarbonyl	3,34 ^[a]

Lưu ý: Et: etyl

Bảng 6 sau đây minh họa theo các không giới hạn các ví dụ về các chất trung gian có công thức (XIVa).



(XIIIa)



(XIVa)

Bảng 6:

Ví dụ số	R ¹	U ^{1a}	V	LogP
XIIIa.01	Br	OMe		3,15 ^[a]
XIIIa.02	Cl	OH		2,05 ^[a]
XIVa.01	Br	OMe	axetyl	2,01 ^[a]
XIVa.02	Br	OH	axetyl	1,39 ^[a]

Lưu ý: Me: methyl, axetyl: -C(=O)-CH₃

Trong các bảng trên, việc đo các giá trị LogP được tiến hành theo hướng dẫn EEC số 79/831 Annex V.A8 bằng HPLC (Sắc ký lỏng hiệu năng cao) 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 dung môi rửa giải (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 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 đưa ra dữ liệu NMR (^1H) của một số hợp chất được mô tả trong các bảng trên.

Dữ liệu ^1H -NMR của các ví dụ được chọn được thể hiện ở dạng danh sách đỉnh ^1H -NMR. Đối với mỗi đỉnh tín hiệu được liệt kê, giá trị δ tính bằng ppm và cường độ tín hiệu để trong ngoặc đơn. Giữa các giá trị δ – cặp cường độ tín hiệu là các dấu chấm phải 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, đặc biệt 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 các tạp chất này có thể là điển hình đối với quy trình điều chế cụ thể. Do đó, các đỉnh của chúng có thể giúp để 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 ^1H -NMR cổ điển.

Chi tiết hơn về sự mô tả dữ liệu NMR với các danh sách đỉnh có thể tìm thấy trong công bố “Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications” của Cơ sở dữ liệu bộ lọc nghiên cứu số 564025.

Bảng A: Danh sách đỉnh NMR

I.01: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2986 (10,0); 6,7692 (0,9); 6,7458 (1,0); 4,2374 (2,3); 4,2136 (7,4); 4,1898 (7,5); 4,1661 (2,5); 2,0459 (0,3); 1,7222 (2,0); 1,7054 (5,5); 1,6946 (5,6); 1,6792 (2,5); 1,6057 (11,6); 1,3404 (2,6); 1,3250 (5,7); 1,3142 (5,8); 1,2927 (8,4); 1,2690 (16,0); 1,2452 (7,7); 0,0464 (0,4); 0,0356 (12,6); 0,0246 (0,4)

I.02: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 8,6811$ (9,2); $8,2115$ (1,4); $3,6200$ (0,3); $3,5087$ (0,6); $3,4532$ (0,7); $3,4350$ (0,7); $3,3804$ (0,8); $3,3674$ (0,8); $3,3592$ (0,8); $3,2641$ (0,7); $3,1691$ (0,8); $2,5129$ (16,4); $2,5086$ (33,1); $2,5041$ (44,1); $2,4996$ (31,6); $2,4953$ (15,0); $2,0770$ (1,6); $1,3876$ (5,8); $1,3757$ (14,5); $1,3676$ (16,0); $1,3571$ (6,8); $1,3178$ (0,6); $1,1827$ (0,6); $1,1756$ (0,4); $1,1432$ (7,2); $1,1326$ (15,7); $1,1245$ (15,0); $1,1126$ (5,6); $0,0000$ (1,2)

I.03: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 9,0297$ (2,9); $4,1005$ (2,1); $4,0828$ (6,7); $4,0651$ (6,7); $4,0473$ (2,1); $3,3285$ (11,9); $2,5220$ (0,4); $2,5133$ (6,0); $2,5088$ (12,5); $2,5042$ (16,6); $2,4995$ (12,0); $2,4950$ (5,9); $1,4637$ (1,8); $1,4515$ (4,4); $1,4431$ (4,8); $1,4322$ (2,0); $1,1946$ (2,2); $1,1820$ (10,0); $1,1753$ (4,9); $1,1641$ (16,0); $1,1463$ (7,1); $-0,0002$ (0,4)

I.04: ^1H -NMR(499,9 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 9,1058$ (3,8); $4,1569$ (2,1); $4,1426$ (6,5); $4,1284$ (6,6); $4,1143$ (2,1); $3,3757$ (1,0); $2,5650$ (0,4); $2,5615$ (0,8); $2,5579$ (1,0); $2,5543$ (0,8); $2,5508$ (0,4); $1,5126$ (1,8); $1,5030$ (4,7); $1,4964$ (5,0); $1,4875$ (2,0); $1,2481$ (7,1); $1,2338$ (16,0); $1,2238$ (5,6); $1,2196$ (9,1); $1,2076$ (1,9)

I.05: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 12,5912$ (0,3); $12,5704$ (0,3); $8,9622$ (5,6); $3,3582$ (16,0); $2,5348$ (7,3); $2,5289$ (15,6); $2,5228$ (21,8); $2,5167$ (15,8); $2,5108$ (7,3); $1,4582$ (2,0); $1,4422$ (5,0); $1,4314$ (5,7); $1,4172$ (2,5); $1,1587$ (2,6); $1,1445$ (5,5); $1,1336$ (5,4); $1,1178$ (2,0); $0,0317$ (1,0); $0,0207$ (30,4); $0,0098$ (1,1)

I.06: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,0605$ (4,1); $8,3150$ (0,5); $4,1032$ (2,2); $4,0855$ (7,1); $4,0677$ (7,1); $4,0500$ (2,3); $3,3287$ (15,8); $2,8923$ (0,7); $2,7326$ (0,6); $2,5263$ (0,4); $2,5216$ (0,6); $2,5128$ (8,7); $2,5084$ (18,0); $2,5038$ (23,9); $2,4992$ (17,7); $2,4948$ (8,9); $1,4546$ (1,8); $1,4425$ (4,6); $1,4343$ (5,1); $1,4233$ (2,1); $1,1961$ (7,7); $1,1783$ (16,0); $1,1693$ (2,6); $1,1604$ (9,6); $1,1499$ (5,1); $1,1378$ (1,8); $-0,0002$ (0,5)

I.07: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,0801$ (2,6); $3,6446$ (16,0); $3,3477$ (11,1); $2,5279$ (2,3); $2,5220$ (3,1); $2,5161$ (2,2); $1,4960$ (1,0); $1,4795$ (2,8); $1,4685$ (3,1); $1,4541$ (1,3); $1,2106$ (1,4); $1,1961$ (3,1); $1,1851$ (2,9); $1,1685$ (1,1); $0,0189$ (2,7)

I.08: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 12,6292$ (0,5); $12,5891$ (0,6); $12,5706$ (0,6); $12,5368$ (0,5); $8,9512$ (15,1); $6,8906$ (0,3); $3,3471$ (16,0); $2,5343$ (14,3); $2,5283$ (29,9); $2,5222$ (40,7); $2,5161$ (28,9); $2,5102$ (13,1); $2,2042$ (0,5); $2,0093$ (1,1); $1,9289$ (0,4); $1,4951$ (0,3); $1,4457$ (5,1); $1,4297$ (12,6); $1,4189$ (14,1); $1,4050$ (6,2); $1,3753$ (4,2); $1,3509$ (0,6); $1,2561$ (0,6); $1,2184$ (0,5); $1,2012$ (1,5); $1,1949$ (1,1); $1,1708$ (0,7); $1,1518$ (6,7); $1,1379$ (14,3); $1,1271$ (13,5); $1,1112$ (5,0); $0,0308$ (1,6); $0,0200$ (45,4); $0,0090$ (1,5)

I.09: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,9370$ (2,9); $8,3118$ (0,8); $4,0946$ (2,2); $4,0769$ (7,2); $4,0592$ (7,3); $4,0414$ (2,3); $3,3293$ (20,0); $2,5272$ (0,4); $2,5224$ (0,6); $2,5138$ (8,8); $2,5093$ (18,0); $2,5047$ (23,6); $2,5001$ (16,8); $2,4956$ (8,0); $1,4601$ (1,8); $1,4478$ (4,6); $1,4395$ (5,0); $1,4285$ (2,1); $1,1997$ (2,3); $1,1887$ (4,9); $1,1803$ (4,9); $1,1726$ (8,1); $1,1682$ (2,2); $1,1549$ (16,0); $1,1371$ (7,5); $-0,0002$ (1,1)

I.10: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4278 (0,8); 7,2987 (6,4); 5,3380 (0,4); 3,7510 (16,0); 1,7477 (1,0); 1,7308 (2,9); 1,7200 (2,9); 1,7045 (1,3); 1,5918 (2,3); 1,3759 (1,3); 1,3604 (2,9); 1,3496 (2,9); 1,3327 (1,0); 0,0366 (8,1)

I.11: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5803 (1,0); 7,2984 (4,3); 3,7517 (16,0); 1,7458 (1,1); 1,7289 (3,1); 1,7181 (3,2); 1,7027 (1,4); 1,5994 (1,5); 1,3788 (1,4); 1,3634 (3,2); 1,3526 (3,2); 1,3356 (1,2); 0,0357 (5,6)

I.12: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5601 (1,2); 7,3006 (3,1); 7,2980 (3,7); 7,2901 (1,0); 3,7551 (13,6); 3,7527 (16,0); 3,7448 (4,5); 1,7476 (1,1); 1,7309 (3,3); 1,7206 (4,0); 1,7117 (1,2); 1,7047 (1,6); 1,6963 (0,5); 1,6041 (1,8); 1,6015 (2,1); 1,5936 (0,6); 1,3815 (1,4); 1,3669 (3,5); 1,3565 (3,9); 1,3472 (1,2); 1,3403 (1,3); 1,3385 (1,3); 1,3304 (0,4); 0,0376 (4,0); 0,0349 (4,9); 0,0270 (1,4)

I.13: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 12,5766 (1,5); 8,8300 (3,7); 3,3459 (16,0); 2,5276 (8,8); 2,5217 (11,9); 2,5158 (8,8); 2,0084 (0,8); 1,4514 (1,4); 1,4350 (3,6); 1,4243 (4,0); 1,4102 (1,7); 1,1940 (0,5); 1,1760 (1,8); 1,1617 (3,8); 1,1509 (3,7); 1,1348 (1,4); 0,0297 (0,4); 0,0190 (8,8); 0,0081 (0,4)

I.14: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 12,5829 (1,4); 8,9016 (2,9); 3,3458 (16,0); 2,5336 (4,3); 2,5278 (8,8); 2,5218 (11,9); 2,5157 (8,7); 2,5099 (4,2); 2,0088 (0,5); 1,4513 (1,1); 1,4350 (2,6); 1,4244 (3,0); 1,4103 (1,3); 1,1942 (0,4); 1,1624 (1,4); 1,1480 (3,0); 1,1374 (2,8); 1,1211 (1,1); 0,0304 (0,4); 0,0195 (11,3); 0,0085 (0,4)

I.15: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 12,6626 (0,4); 12,6476 (0,4); 12,6242 (0,4); 12,5754 (0,4); 8,9164 (14,6); 4,0605 (0,6); 4,0368 (0,6); 3,3516 (4,4); 3,1902 (0,4); 2,5339 (12,4); 2,5280 (26,2); 2,5219 (35,8); 2,5158 (26,0); 2,5098 (12,2); 2,0090 (2,4); 1,9284 (2,2); 1,4449 (5,5); 1,4288 (14,0); 1,4179 (16,0); 1,4041 (7,1); 1,3511 (0,6); 1,3028 (0,5); 1,2812 (0,6); 1,2607 (0,6); 1,2382 (0,7); 1,2281 (0,8); 1,2181 (1,0); 1,2002 (0,9); 1,1944 (1,9); 1,1758 (7,4); 1,1618 (15,8); 1,1509 (14,7); 1,1348 (5,7); 1,0843 (0,4); 0,0304 (1,3); 0,0195 (37,9); 0,0085 (1,5)

I.16: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2989 (0,5); 6,8148 (0,6); 6,7916 (0,6); 4,1302 (0,3); 3,7323 (16,0); 2,0677 (1,4); 1,7485 (0,3); 1,7162 (1,1); 1,6993 (3,0); 1,6885 (3,0); 1,6730 (1,3); 1,3363 (1,4); 1,3208 (3,0); 1,3100 (3,1); 1,2931 (1,2); 1,2817 (0,8); 1,2578 (0,4); 0,0212 (0,7)

I.17: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8909 (4,5); 7,9547 (0,3); 7,3701 (1,3); 7,3652 (1,2); 7,3499 (4,4); 7,3353 (10,1); 7,3237 (15,1); 7,3124 (3,8); 7,3057 (4,6); 7,2940 (0,9); 7,2890 (0,8); 5,1153 (16,0); 3,3640 (0,8); 3,3403 (45,6); 2,8925 (2,0); 2,7339 (1,9); 2,5090 (23,1); 2,5049 (29,3); 2,5010 (23,4); 1,4989 (2,3); 1,4865 (5,9); 1,4784 (6,6); 1,4674 (2,7); 1,2439 (3,0); 1,2328 (6,5); 1,2247 (6,2); 1,2122 (2,2); -0,0002 (0,6)

I.18: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8138 (9,9); 7,9545 (0,5); 5,0663 (3,3); 5,0525 (6,2); 5,0383 (3,3); 4,0154 (0,4); 3,3355 (69,9); 2,8937 (3,7); 2,7341 (3,2); 2,6742 (0,4); 2,5138 (26,1); 2,5097 (48,7); 2,5053 (62,0); 2,5008 (46,2); 2,4966 (23,5); 2,3321 (0,4); 1,7582 (5,2); 1,7445 (5,4); 1,7324 (3,3); 1,7256 (3,8); 1,6064 (1,2); 1,5704 (14,0); 1,5574 (13,7); 1,5512 (14,4); 1,5397 (15,1); 1,5194 (6,4); 1,5100 (4,8); 1,4488 (0,3); 1,4276 (0,4); 1,4107 (5,7); 1,3984 (14,6); 1,3902 (16,0); 1,3793 (6,9); 1,3581 (0,6); 1,3395 (0,6); 1,2380 (1,1); 1,2079 (0,6); 1,1884 (0,4); 1,1683 (7,1); 1,1572 (15,4); 1,1490 (14,8); 1,1367 (5,5); 0,8673 (0,4); 0,8491 (0,7); -0,0002 (1,8)

I.19: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7382 (0,9); 3,3348 (7,5); 2,8936 (0,8); 2,7341 (0,7); 2,5135 (2,5); 2,5094 (4,9); 2,5050 (6,3); 2,5006 (4,8); 1,3882 (0,6); 1,3761 (1,6); 1,3673 (2,4); 1,3580 (16,0); 1,1269 (0,6); 1,1160 (1,5); 1,1079 (1,4); 1,0957 (0,5)

I.20: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8486 (2,2); 3,8201 (5,6); 3,8043 (5,6); 3,3352 (14,5); 2,8935 (0,5); 2,7337 (0,4); 2,5095 (10,7); 2,5051 (13,9); 2,5007 (10,9); 1,8507 (0,5); 1,8342 (1,0); 1,8177 (1,2); 1,8011 (1,0); 1,7847 (0,5); 1,4463 (1,2); 1,4339 (3,2); 1,4256 (3,5); 1,4148 (1,5); 1,2105 (1,5); 1,1994 (3,4); 1,1912 (3,3); 1,1788 (1,2); 0,8517 (16,0); 0,8348 (15,4); -0,0002 (0,4)

I.21: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8241 (3,8); 4,0313 (4,5); 4,0153 (9,1); 3,9993 (4,5); 3,3361 (30,6); 2,8934 (0,8); 2,7344 (0,6); 2,5133 (10,7); 2,5094 (19,3); 2,5049 (24,0); 2,5004 (17,5); 2,4962 (8,6); 1,5346 (0,9); 1,5181 (2,9); 1,5111 (1,2); 1,5014 (3,8); 1,4811 (3,3); 1,4653 (1,3); 1,4402 (2,2); 1,4279 (5,6); 1,4197 (6,0); 1,4087 (2,6); 1,3338 (0,6); 1,3152 (2,4); 1,2962 (3,8); 1,2774 (3,7); 1,2592 (2,2); 1,2407 (1,1); 1,1991 (2,7); 1,1881 (5,9); 1,1799 (5,6); 1,1674 (2,0); 0,8672 (8,2); 0,8488 (16,0); 0,8303 (7,0); -0,0002 (0,5)

I.22: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7943 (2,1); 4,8803 (0,4); 4,8648 (1,2); 4,8492 (1,6); 4,8336 (1,2); 4,8180 (0,5); 3,3346 (14,2); 2,8933 (0,5); 2,7335 (0,5); 2,5092 (9,6); 2,5049 (12,5); 2,5005 (9,7); 1,4276 (1,2); 1,4152 (3,1); 1,4071 (3,4); 1,3961 (1,4); 1,1765 (1,5); 1,1654 (3,5); 1,1568 (4,0); 1,1495 (16,0); 1,1338 (15,5); -0,0002 (0,4)

I.23: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8683 (6,0); 7,9532 (1,0); 4,7109 (15,5); 4,7049 (16,0); 3,5563 (3,9); 3,5504 (7,9); 3,5444 (3,9); 3,3357 (40,7); 2,8931 (6,8); 2,7332 (6,0); 2,5092 (26,5); 2,5048 (34,7); 2,5004 (27,3); 1,4878 (3,0); 1,4750 (8,0); 1,4668 (9,0); 1,4558 (3,8); 1,4158 (0,3); 1,2946 (0,3); 1,2551 (3,9); 1,2437 (8,8); 1,2356 (8,8); 1,2229 (3,1); -0,0002 (1,2)

I.24: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,8619$ (9,8); $5,9102$ (1,5); $5,8977$ (3,2); $5,8845$ (2,8); $5,8711$ (3,8); $5,8675$ (2,3); $5,8585$ (2,2); $5,8546$ (4,0); $5,8414$ (3,2); $5,8281$ (4,0); $5,8156$ (2,0); $5,3004$ (2,6); $5,2965$ (6,8); $5,2923$ (7,1); $5,2572$ (2,3); $5,2533$ (5,9); $5,2492$ (6,1); $5,1924$ (7,1); $5,1888$ (7,0); $5,1660$ (6,5); $5,1623$ (6,5); $4,5721$ (9,5); $4,5685$ (15,8); $4,5649$ (10,8); $4,5599$ (10,6); $4,5560$ (15,7); $3,3373$ (77,4); $2,8935$ (0,8); $2,7340$ (0,7); $2,6740$ (0,4); $2,5273$ (1,0); $2,5094$ (44,6); $2,5050$ (57,9); $2,5007$ (44,5); $2,3320$ (0,4); $1,4793$ (5,4); $1,4669$ (14,4); $1,4586$ (16,0); $1,4476$ (6,8); $1,4078$ (0,6); $1,2739$ (0,7); $1,2345$ (7,6); $1,2233$ (15,3); $1,2150$ (14,9); $1,2026$ (5,4); $-0,0002$ (1,6)

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

$\delta = 9,1100$ (5,0); $7,9531$ (0,5); $7,3885$ (0,8); $7,3853$ (1,0); $7,3814$ (0,6); $7,3642$ (3,4); $7,3507$ (16,0); $7,3475$ (12,5); $7,3354$ (4,2); $7,3318$ (3,7); $7,3227$ (1,4); $7,3142$ (2,0); $7,3047$ (0,7); $7,2988$ (0,6); $5,1218$ (15,4); $3,3338$ (90,0); $2,8910$ (3,3); $2,7317$ (2,8); $2,6755$ (0,4); $2,6717$ (0,5); $2,5454$ (0,3); $2,5249$ (1,5); $2,5070$ (59,0); $2,5026$ (74,4); $2,4982$ (55,2); $2,3296$ (0,4); $2,3255$ (0,3); $1,5112$ (2,1); $1,4988$ (5,4); $1,4907$ (5,9); $1,4796$ (2,4); $1,2748$ (0,3); $1,2586$ (0,4); $1,2350$ (3,0); $1,2238$ (5,9); $1,2156$ (5,7); $1,2032$ (2,1); $-0,0002$ (1,7)

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

$\delta = 9,0283$ (8,2); $8,3170$ (16,0); $5,0874$ (2,6); $5,0738$ (5,1); $5,0651$ (2,2); $5,0596$ (2,6); $3,3357$ (51,0); $3,3119$ (7,0); $2,8929$ (0,8); $2,7332$ (0,7); $2,5267$ (0,9); $2,5089$ (39,2); $2,5045$ (51,3); $2,5000$ (39,3); $2,3312$ (0,3); $1,7732$ (4,4); $1,7597$ (4,0); $1,7464$ (2,9); $1,7402$ (3,1); $1,7326$ (2,3); $1,6570$ (0,4); $1,6041$ (12,3); $1,5947$ (7,7); $1,5893$ (7,0); $1,5738$ (7,5); $1,5626$ (5,5); $1,5272$ (4,6); $1,5118$ (2,4); $1,4854$ (0,4); $1,4259$ (4,6); $1,4137$ (12,1); $1,4054$ (13,4); $1,3946$ (5,7); $1,3546$ (0,5); $1,2385$ (0,7); $1,2048$ (0,4); $1,1650$ (5,2); $1,1540$ (12,1); $1,1458$ (11,8); $1,1336$ (4,3); $-0,0002$ (1,3)

I.27: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,9647 (1,0); 8,3172 (0,8); 3,3335 (7,9); 3,3097 (0,4); 2,5084 (5,6); 2,5040 (7,2); 2,4996 (5,4); 1,3979 (0,7); 1,3799 (16,0); 1,3678 (1,2); 1,1212 (0,6); 1,1103 (1,4); 1,1022 (1,3); 1,0901 (0,5)

I.28: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0520 (2,7); 8,3171 (1,4); 3,8353 (5,5); 3,8194 (5,5); 3,3332 (14,2); 3,3094 (0,7); 2,5084 (11,7); 2,5042 (14,8); 2,5000 (11,6); 1,8772 (0,5); 1,8607 (1,0); 1,8441 (1,3); 1,8276 (1,0); 1,8111 (0,5); 1,4642 (1,3); 1,4519 (3,4); 1,4438 (3,7); 1,4329 (1,5); 1,2073 (1,6); 1,1963 (3,6); 1,1881 (3,5); 1,1759 (1,2); 0,8744 (16,0); 0,8575 (15,3); -0,0002 (0,4)

I.29: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0428 (4,7); 4,0456 (4,5); 4,0297 (9,1); 4,0137 (4,5); 3,3335 (31,7); 2,5083 (23,9); 2,5039 (30,4); 2,4994 (22,7); 1,5587 (0,9); 1,5421 (2,8); 1,5350 (1,2); 1,5255 (3,7); 1,5207 (2,8); 1,5052 (3,2); 1,4894 (1,3); 1,4557 (2,2); 1,4434 (5,8); 1,4352 (6,3); 1,4243 (2,6); 1,3593 (0,7); 1,3407 (2,3); 1,3217 (3,7); 1,3029 (3,7); 1,2847 (2,2); 1,2665 (0,6); 1,2353 (0,5); 1,1949 (2,7); 1,1839 (6,2); 1,1757 (6,0); 1,1634 (2,2); 0,8804 (8,2); 0,8620 (16,0); 0,8436 (7,0); -0,0002 (0,9)

I.30: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0439 (12,4); 8,3171 (0,9); 4,9371 (1,2); 4,9190 (4,6); 4,9005 (6,8); 4,8820 (4,6); 4,8639 (1,2); 3,3339 (75,1); 3,3103 (0,6); 2,8924 (1,8); 2,7329 (1,5); 2,6731 (0,4); 2,5258 (1,2); 2,5125 (25,8); 2,5083 (48,8); 2,5039 (62,3); 2,4994 (46,0); 2,4951 (22,9); 2,3307 (0,4); 2,2868 (1,8); 2,2802 (2,7); 2,2725 (2,4); 2,2670 (3,8); 2,2607 (5,2); 2,2564 (5,4); 2,2496 (5,0); 2,2426 (5,5); 2,2368 (5,9); 2,2320 (4,6); 2,2264 (3,0); 2,2188 (3,3); 2,2125 (2,5); 2,0102 (1,4); 2,0034 (1,1); 1,9897 (2,9); 1,9852 (5,5); 1,9785 (3,7); 1,9658 (5,6); 1,9602 (6,5); 1,9547 (5,0); 1,9419 (4,3); 1,9354 (5,2); 1,9177 (1,5); 1,9110 (1,6); 1,7708 (0,8); 1,7652 (1,4); 1,7594 (0,9); 1,7393 (3,7); 1,7332 (2,1); 1,7198 (2,1); 1,7140 (3,6); 1,6946 (0,8); 1,6888 (1,3); 1,6832 (0,7); 1,6326 (1,1); 1,6124 (2,3); 1,6071 (2,3); 1,5870 (4,7); 1,5820 (2,6); 1,5658 (2,5); 1,5610 (3,9); 1,5411 (1,8); 1,5355 (1,4); 1,5152 (0,6); 1,4531 (5,7); 1,4408 (14,8); 1,4326 (16,0); 1,4216 (6,6); 1,3817 (0,6); 1,2380 (1,0); 1,2269 (0,7); 1,1866 (6,9); 1,1755 (15,5); 1,1673 (14,9); 1,1550 (5,4); -0,0002 (1,8)

I.31: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0451 (4,3); 8,3168 (0,9); 4,0055 (4,8); 3,9895 (10,0); 3,9734 (4,9); 3,3349 (36,5); 3,3110 (0,6); 2,5122 (13,2); 2,5081 (24,6); 2,5036 (31,4); 2,4991 (23,3); 2,4949 (11,8); 1,6014 (0,6); 1,5832 (2,2); 1,5666 (4,4); 1,5485 (4,6); 1,5318 (2,4); 1,5139 (0,6); 1,4617 (2,2); 1,4495 (5,8); 1,4412 (6,3); 1,4303 (2,6); 1,2386 (0,6); 1,1989 (2,7); 1,1879 (6,2); 1,1796 (5,9); 1,1674 (2,2); 0,8847 (8,1); 0,8663 (16,0); 0,8477 (7,3); -0,0002 (0,8)

I.32: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0342 (2,3); 4,8971 (0,4); 4,8816 (1,1); 4,8660 (1,5); 4,8504 (1,1); 4,8348 (0,4); 3,3320 (24,4); 2,8920 (0,8); 2,7325 (0,7); 2,5075 (18,3); 2,5032 (23,4); 2,4990 (17,9); 1,4371 (1,1); 1,4250 (2,9); 1,4168 (3,2); 1,4059 (1,3); 1,1708 (15,4); 1,1553 (16,0); 1,1379 (1,2); -0,0002 (0,6)

I.33: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0877 (7,0); 8,3153 (3,0); 4,7238 (15,8); 4,7178 (16,0); 3,5684 (3,8); 3,5626 (7,5); 3,5566 (3,8); 3,3345 (27,7); 3,3106 (1,4); 2,8928 (0,8); 2,7334 (0,7); 2,5085 (24,4); 2,5041 (31,4); 2,4998 (23,8); 1,5042 (3,3); 1,4917 (8,7); 1,4834 (9,5); 1,4723 (4,0); 1,4325 (0,3); 1,2914 (0,3); 1,2517 (4,2); 1,2405 (9,4); 1,2323 (9,2); 1,2197 (3,3); -0,0002 (0,8)

I.34: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0748 (4,4); 8,3166 (16,0); 5,9275 (0,8); 5,9149 (1,8); 5,9015 (1,6); 5,8884 (2,1); 5,8846 (1,4); 5,8756 (1,3); 5,8718 (2,3); 5,8584 (1,9); 5,8453 (2,2); 5,8327 (1,1); 5,3238 (4,0); 5,3196 (4,1); 5,3155 (1,8); 5,2806 (3,4); 5,2764 (3,6); 5,2724 (1,6); 5,2071 (4,0); 5,2034 (4,0); 5,1807 (3,7); 5,1770 (3,7); 4,5845 (5,7); 4,5810 (9,2); 4,5772 (6,5); 4,5723 (6,4); 4,5684 (9,0); 4,5648 (5,7); 3,3339 (17,6); 3,3103 (5,7); 2,8925 (1,2); 2,7329 (1,0); 2,5083 (26,6); 2,5040 (33,8); 2,4996 (26,1); 1,4951 (3,3); 1,4827 (8,7); 1,4745 (9,4); 1,4635 (4,0); 1,4236 (0,3); 1,2703 (0,4); 1,2305 (4,1); 1,2194 (9,0); 1,2112 (8,8); 1,1988 (3,2); -0,0002 (1,0)

I.35: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5189 (0,4); 7,3862 (6,5); 7,2981 (0,3); 7,2601 (66,7); 6,9969 (0,4); 5,0451 (1,1); 5,0270 (4,0); 5,0084 (5,9); 4,9897 (4,0); 4,9708 (1,1); 2,3648 (1,8); 2,3582 (2,5); 2,3378 (5,4); 2,3342 (5,5); 2,3271 (5,1); 2,3203 (5,6); 2,3140 (6,1); 2,2958 (3,1); 2,0916 (1,4); 2,0852 (1,2); 2,0674 (4,9); 2,0609 (3,8); 2,0476 (5,3); 2,0424 (6,5); 2,0369 (5,2); 2,0231 (4,0); 2,0170 (4,8); 1,9986 (1,4); 1,9914 (1,5); 1,8122 (1,3); 1,7870 (3,5); 1,7614 (3,4); 1,7362 (1,3); 1,7150 (0,4); 1,6777 (5,2); 1,6652 (14,8); 1,6573 (16,0); 1,6456 (6,4); 1,6131 (4,1); 1,5861 (3,6); 1,5652 (2,1); 1,5599 (2,1); 1,5408 (71,7); 1,3777 (0,5); 1,3383 (6,3); 1,3267 (15,1); 1,3188 (15,1); 1,3062 (5,3); 1,2552 (1,0); 0,8823 (0,3); 0,1472 (0,4); 0,0344 (0,4); -0,0002 (78,1); -0,1493 (0,4)

I.36: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8043 (10,9); 8,3154 (0,5); 4,9153 (1,2); 4,8967 (4,7); 4,8782 (7,1); 4,8597 (4,8); 4,8411 (1,3); 3,3397 (106,7); 2,8931 (1,3); 2,7335 (1,2); 2,6739 (0,4); 2,5050 (61,4); 2,3315 (0,4); 2,2724 (1,8); 2,2669 (2,7); 2,2473 (6,1); 2,2437 (6,2); 2,2367 (5,5); 2,2238 (7,0); 2,2054 (3,3); 2,1997 (2,7); 1,9762 (1,4); 1,9702 (1,2); 1,9516 (5,4); 1,9455 (4,1); 1,9264 (7,3); 1,9074 (4,4); 1,9017 (5,6); 1,8840 (1,5); 1,8769 (1,7); 1,7492 (1,6); 1,7231 (4,1); 1,6978 (4,0); 1,6728 (1,4); 1,6235 (1,0); 1,5983 (2,7); 1,5776 (4,6); 1,5522 (4,1); 1,5316 (1,8); 1,5059 (0,5); 1,4454 (5,1); 1,4328 (14,0); 1,4249 (16,0); 1,4140 (6,7); 1,3742 (0,6); 1,2328 (1,1); 1,1913 (6,3); 1,1801 (14,8); 1,1722 (15,0); 1,1599 (5,4); -0,0002 (2,7)

I.37: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8292 (3,9); 3,9916 (5,0); 3,9756 (10,1); 3,9596 (5,0); 3,3366 (28,9); 2,8936 (0,5); 2,7340 (0,5); 2,5096 (17,4); 2,5052 (22,1); 2,5008 (16,6); 1,5774 (0,6); 1,5593 (2,4); 1,5425 (4,7); 1,5246 (4,9); 1,5076 (2,5); 1,4899 (0,7); 1,4474 (2,3); 1,4350 (5,9); 1,4268 (6,4); 1,4158 (2,7); 1,2389 (0,4); 1,2037 (2,8); 1,1926 (6,2); 1,1844 (5,9); 1,1720 (2,1); 0,8624 (8,2); 0,8440 (16,0); 0,8254 (7,4); -0,0002 (0,5)

I.38: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5059 (6,4); 7,2606 (24,7); 5,0390 (1,0); 5,0196 (3,5); 5,0013 (5,5); 4,9827 (4,1); 4,9646 (1,5); 2,9565 (0,5); 2,8836 (0,4); 2,3551 (2,3); 2,3355 (5,5); 2,3306 (5,9); 2,3241 (5,8); 2,3172 (6,4); 2,3109 (6,8); 2,2932 (4,1); 2,2874 (3,2); 2,0831 (1,2); 2,0756 (1,2); 2,0572 (4,7); 2,0506 (4,0); 2,0373 (5,6); 2,0317 (6,7); 2,0264 (5,9); 2,0130 (4,9); 2,0067 (5,4); 1,9886 (2,2); 1,9815 (2,0); 1,8102 (1,3); 1,7841 (3,4); 1,7582 (3,6); 1,7334 (1,6); 1,6758 (4,6); 1,6631 (13,7); 1,6554 (16,0); 1,6438 (8,6); 1,6112 (4,5); 1,5850 (3,9); 1,5477 (25,8); 1,3753 (0,6); 1,3667 (0,4); 1,3347 (5,6); 1,3231 (14,1); 1,3154 (15,3); 1,3030 (7,3); 1,2545 (2,5); 0,0698 (0,7); -0,0002 (30,6)

I.39: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5215 (3,5); 7,2607 (14,3); 7,2447 (1,6); 4,0901 (5,2); 4,0736 (10,9); 4,0572 (6,4); 2,9559 (0,4); 2,8839 (0,4); 1,6877 (2,8); 1,6751 (8,0); 1,6673 (8,9); 1,6553 (6,9); 1,6367 (6,4); 1,6188 (6,5); 1,6014 (3,8); 1,5839 (1,5); 1,5481 (11,9); 1,3394 (3,2); 1,3277 (8,0); 1,3199 (8,5); 1,3075 (4,0); 1,2547 (1,0); 0,9240 (8,1); 0,9055 (16,0); 0,8870 (8,8); 0,0695 (1,5); -0,0002 (17,6); -0,0158 (2,3)

I.40: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3772 (3,6); 7,2610 (11,3); 7,2444 (1,2); 4,0885 (5,3); 4,0721 (10,8); 4,0556 (6,3); 2,9558 (0,6); 2,8834 (0,5); 1,6880 (2,9); 1,6754 (8,0); 1,6677 (9,1); 1,6545 (5,8); 1,6344 (6,3); 1,6168 (6,7); 1,5991 (3,9); 1,5815 (1,5); 1,5514 (7,0); 1,3767 (0,3); 1,3364 (3,4); 1,3247 (8,1); 1,3170 (8,5); 1,3045 (3,8); 1,2549 (1,3); 0,9216 (8,1); 0,9032 (16,0); 0,8847 (8,7); 0,0694 (1,0); -0,0002 (13,6); -0,0166 (1,7)

I.41: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4157 (3,3); 7,2920 (0,4); 7,2600 (34,1); 4,0942 (5,3); 4,0778 (10,8); 4,0613 (5,6); 1,6905 (2,7); 1,6779 (8,2); 1,6700 (8,3); 1,6592 (5,6); 1,6431 (5,6); 1,6250 (5,8); 1,6075 (3,0); 1,5899 (1,0); 1,5396 (36,1); 1,3445 (3,2); 1,3328 (7,8); 1,3249 (7,9); 1,3125 (2,9); 1,2573 (0,4); 0,9299 (8,3); 0,9114 (16,0); 0,8928 (7,7); -0,0002 (40,3); -0,0415 (0,3)

I.42: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3665 (6,4); 7,3015 (0,3); 7,2603 (37,2); 5,0356 (1,0); 5,0175 (3,9); 4,9990 (5,8); 4,9801 (4,0); 4,9612 (1,2); 2,3607 (1,8); 2,3539 (2,5); 2,3358 (5,4); 2,3296 (5,4); 2,3231 (5,0); 2,3162 (5,6); 2,3106 (5,9); 2,2919 (3,2); 2,2855 (2,4); 2,0793 (1,4); 2,0723 (1,2); 2,0541 (4,9); 2,0475 (3,7); 2,0343 (5,5); 2,0291 (6,3); 2,0233 (4,9); 2,0099 (4,3); 2,0035 (4,8); 1,9855 (1,5); 1,9790 (1,6); 1,8102 (1,3); 1,7833 (3,4); 1,7578 (3,4); 1,7328 (1,3); 1,7163 (0,5); 1,6770 (5,3); 1,6645 (14,8); 1,6566 (16,0); 1,6449 (6,6); 1,6361 (3,0); 1,6311 (2,8); 1,6106 (4,3); 1,5843 (3,5); 1,5635 (2,1); 1,5578 (2,3); 1,5438 (35,8); 1,3713 (0,6); 1,3314 (6,3); 1,3198 (15,2); 1,3119 (14,9); 1,2994 (5,5); 1,2597 (0,8); -0,0002 (46,1)

I.43: ^1H -NMR(500,1 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 9,0051$ (4,3); $4,0905$ (2,1); $4,0764$ (6,6); $4,0622$ (6,7); $4,0480$ (2,2); $3,3080$ (14,8); $2,5040$ (9,1); $2,5007$ (12,5); $2,4974$ (9,4); $1,4509$ (1,9); $1,4412$ (5,3); $1,4347$ (5,7); $1,4258$ (2,2); $1,1791$ (2,8); $1,1751$ (7,8); $1,1705$ (6,3); $1,1611$ (16,0); $1,1544$ (2,5); $1,1468$ (7,0); $-0,0002$ (7,6); $-0,0064$ (0,3)

I.44: ^1H -NMR(600,1 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 8,8524$ (2,3); $4,0815$ (2,1); $4,0766$ (0,5); $4,0697$ (6,8); $4,0649$ (0,5); $4,0579$ (6,8); $4,0461$ (2,1); $3,3284$ (53,8); $2,5101$ (5,0); $2,5071$ (11,1); $2,5040$ (15,7); $2,5010$ (11,2); $2,4979$ (5,0); $1,4515$ (2,0); $1,4433$ (4,7); $1,4378$ (5,1); $1,4303$ (2,0); $1,1993$ (2,0); $1,1917$ (4,8); $1,1862$ (4,8); $1,1781$ (1,7); $1,1650$ (0,4); $1,1541$ (7,9); $1,1423$ (16,0); $1,1305$ (7,4); $-0,0001$ (0,7)

I.45: ^1H -NMR(600,1 MHz, d_6 -DMSO):

$\delta = 8,8543$ (1,3); $3,6179$ (0,9); $3,6093$ (16,0); $3,3227$ (14,6); $2,8930$ (0,9); $2,7338$ (0,7); $2,5095$ (2,9); $2,5065$ (6,4); $2,5034$ (9,0); $2,5004$ (6,4); $2,4974$ (2,8); $1,4613$ (1,2); $1,4533$ (2,8); $1,4477$ (3,0); $1,4402$ (1,2); $1,2153$ (1,2); $1,2077$ (2,8); $1,2022$ (2,8); $1,1940$ (1,0); $-0,0001$ (0,5)

I.46: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

$\delta = 7,5141$ (4,4); $7,2604$ (37,0); $7,2304$ (0,5); $5,2992$ (3,3); $3,9606$ (15,6); $3,9426$ (16,0); $1,7060$ (3,9); $1,6935$ (11,1); $1,6855$ (11,6); $1,6739$ (4,9); $1,6338$ (0,6); $1,5462$ (57,4); $1,5165$ (0,9); $1,4977$ (0,4); $1,3960$ (0,4); $1,3563$ (4,7); $1,3447$ (11,5); $1,3366$ (11,6); $1,3241$ (4,2); $1,2862$ (0,5); $1,2564$ (0,3); $1,1274$ (0,6); $1,1204$ (0,9); $1,1087$ (1,8); $1,1013$ (1,6); $1,0894$ (2,7); $1,0774$ (1,7); $1,0706$ (1,9); $1,0584$ (1,1); $1,0515$ (0,8); $1,0391$ (0,4); $0,5580$ (2,0); $0,5455$ (6,9); $0,5430$ (7,0); $0,5256$ (7,3); $0,5111$ (2,6); $0,4948$ (0,6); $0,4744$ (0,4); $0,2727$ (2,4); $0,2607$ (8,9); $0,2463$ (8,5); $0,2343$ (2,3); $-0,0002$ (46,0); $-0,0295$ (0,7)

I.47: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5458 (3,7); 7,2614 (16,3); 5,2996 (3,9); 4,7166 (16,0); 4,7105 (15,2); 2,4664 (4,2); 2,4603 (7,4); 2,4543 (3,7); 1,7574 (3,3); 1,7446 (9,4); 1,7367 (9,3); 1,7246 (3,7); 1,6843 (0,3); 1,5599 (20,4); 1,3786 (3,9); 1,3668 (9,5); 1,3588 (9,2); 1,3459 (3,2); 1,3072 (0,4); 1,2589 (0,4); -0,0002 (18,1)

I.48: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5431 (6,3); 7,2616 (21,2); 5,9182 (1,2); 5,9043 (2,5); 5,8915 (2,3); 5,8779 (3,3); 5,8615 (3,3); 5,8486 (2,6); 5,8351 (3,1); 5,8213 (1,6); 5,3101 (6,4); 5,3067 (6,1); 5,2996 (4,1); 5,2671 (5,5); 5,2638 (5,0); 5,2298 (6,8); 5,2270 (6,0); 5,2037 (6,2); 5,2009 (5,6); 4,6224 (14,6); 4,6085 (13,9); 1,7201 (5,4); 1,7075 (15,7); 1,6997 (15,4); 1,6879 (6,1); 1,6480 (0,7); 1,5659 (17,2); 1,3958 (0,5); 1,3556 (6,6); 1,3439 (16,0); 1,3360 (15,2); 1,3233 (5,6); 1,3053 (0,6); 1,2980 (0,6); 1,2844 (0,6); 1,2559 (1,1); 1,2249 (0,4); 1,2093 (0,3); -0,0002 (23,4)

I.49: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5197 (0,4); 7,4793 (5,6); 7,2611 (25,1); 5,2993 (9,1); 1,6441 (0,6); 1,6362 (0,5); 1,6050 (5,0); 1,5926 (15,0); 1,5847 (15,8); 1,5733 (7,0); 1,5559 (21,6); 1,5334 (1,4); 1,4885 (0,4); 1,4730 (0,6); 1,4636 (1,0); 1,4337 (187,2); 1,3890 (1,6); 1,3308 (1,0); 1,3237 (0,7); 1,3177 (0,8); 1,3097 (0,8); 1,2910 (6,3); 1,2796 (15,3); 1,2717 (16,0); 1,2593 (6,0); 1,2365 (0,7); 1,2246 (1,9); 1,2089 (1,7); 1,2010 (0,6); 1,1856 (0,4); 0,9024 (0,6); 0,8853 (0,7); -0,0002 (32,3)

I.50: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5269 (2,9); 7,3898 (0,6); 7,3849 (0,9); 7,3642 (3,1); 7,3504 (6,5); 7,3391 (5,6); 7,3299 (10,1); 7,3244 (11,4); 7,3172 (6,7); 7,3082 (11,4); 7,2932 (3,3); 7,2591 (11,8); 5,2968 (1,2); 5,1523 (16,0); 5,1176 (12,2); 1,8406 (1,4); 1,7640 (0,5); 1,7476 (0,4); 1,7242 (2,3); 1,7115 (6,5); 1,7036 (6,7); 1,6918 (3,0); 1,6526 (0,4); 1,3617 (2,6); 1,3500 (6,5); 1,3418 (7,0); 1,3284 (7,5); 1,3201 (6,5); 1,3105 (2,8); 1,2704 (0,5); 1,2567 (0,6); 1,0327 (2,2); 1,0230 (5,8); 1,0150 (5,4); 1,0046 (2,1); -0,0002 (16,1)

I.51: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4404 (1,3); 7,2605 (9,7); 4,7212 (5,9); 4,7152 (5,5); 2,4674 (1,6); 2,4613 (2,7); 2,4552 (1,3); 1,7580 (1,2); 1,7452 (3,5); 1,7373 (3,3); 1,7253 (1,3); 1,5559 (2,8); 1,3867 (1,5); 1,3747 (3,5); 1,3668 (3,3); 1,3540 (1,2); 1,3038 (3,3); 1,2653 (14,4); 0,8985 (6,6); 0,8820 (16,0); 0,8644 (7,0); -0,0002 (12,0)

I.52: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5190 (0,4); 7,4370 (6,1); 7,2605 (61,6); 5,9240 (1,2); 5,9102 (2,6); 5,8970 (2,4); 5,8839 (3,4); 5,8673 (3,6); 5,8538 (2,7); 5,8410 (3,3); 5,8270 (1,8); 5,3163 (6,2); 5,3129 (6,3); 5,2733 (5,4); 5,2699 (5,4); 5,2323 (6,8); 5,2294 (6,6); 5,2062 (6,2); 5,2032 (6,0); 4,6266 (15,0); 4,6127 (14,6); 1,7219 (5,4); 1,7093 (15,6); 1,7013 (16,0); 1,6896 (6,4); 1,6490 (0,5); 1,5865 (0,3); 1,5486 (109,8); 1,5036 (0,4); 1,4029 (0,6); 1,3625 (6,5); 1,3507 (15,9); 1,3427 (16,0); 1,3301 (5,5); 1,2918 (0,4); 1,2592 (0,6); 0,8820 (0,4); -0,0002 (76,2); -0,1497 (0,4)

I.53: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3512 (5,7); 7,2616 (25,2); 1,6479 (0,6); 1,6401 (0,4); 1,6096 (5,0); 1,5972 (15,5); 1,5893 (16,0); 1,5779 (7,0); 1,5624 (35,2); 1,5385 (1,2); 1,4846 (0,4); 1,4776 (0,5); 1,4647 (0,3); 1,4392 (191,8); 1,3969 (0,6); 1,3905 (0,4); 1,3261 (0,9); 1,3196 (0,7); 1,3115 (0,6); 1,2860 (6,4); 1,2746 (16,0); 1,2666 (15,9); 1,2543 (5,9); 1,2311 (1,8); 1,2154 (1,9); 1,2071 (0,5); 1,1913 (0,4); 0,9083 (0,6); 0,8914 (0,7); 0,8820 (0,4); 0,8758 (0,4); -0,0002 (31,0)

I.54: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4142 (2,9); 7,3860 (0,5); 7,3608 (1,7); 7,3510 (3,5); 7,3399 (4,7); 7,3279 (11,2); 7,3155 (11,4); 7,2987 (3,0); 7,2599 (29,4); 5,1558 (16,0); 5,1200 (4,3); 1,7271 (2,4); 1,7145 (6,5); 1,7065 (6,8); 1,6948 (3,0); 1,6536 (1,3); 1,5975 (4,0); 1,4113 (0,4); 1,3708 (2,6); 1,3591 (6,5); 1,3511 (6,6); 1,3382 (2,8); 1,3346 (2,6); 1,3264 (2,3); 1,3163 (1,2); 1,3012 (0,5); 1,2756 (0,3); 1,2548 (0,6); 1,0540 (0,8); 1,0440 (1,9); 1,0361 (1,8); 1,0256 (0,7); -0,0002 (36,3)

I.55: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4866 (5,0); 7,2611 (25,0); 5,2994 (16,0); 5,2067 (2,2); 5,1926 (4,0); 5,1865 (3,1); 5,1778 (2,4); 5,1718 (1,3); 1,8540 (1,0); 1,8392 (1,7); 1,8210 (3,2); 1,8063 (4,7); 1,7921 (3,4); 1,7669 (1,2); 1,6868 (4,6); 1,6581 (9,4); 1,6432 (8,6); 1,6306 (14,8); 1,6228 (15,0); 1,6111 (7,3); 1,5806 (4,1); 1,5713 (5,2); 1,5570 (55,3); 1,5170 (0,8); 1,3597 (0,4); 1,3194 (4,9); 1,3078 (12,0); 1,2999 (11,7); 1,2874 (4,2); 1,2596 (0,5); 1,2491 (0,4); -0,0002 (29,4)

I.56: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5276 (1,4); 7,2608 (10,1); 5,2994 (2,9); 3,9051 (5,4); 3,8888 (5,5); 1,9400 (0,5); 1,9234 (0,9); 1,9067 (1,2); 1,8900 (1,0); 1,8732 (0,5); 1,6919 (1,2); 1,6794 (3,4); 1,6714 (3,6); 1,6598 (1,4); 1,5527 (19,6); 1,3432 (1,5); 1,3315 (3,5); 1,3235 (3,6); 1,3110 (1,2); 0,9024 (16,0); 0,8856 (15,5); -0,0002 (12,1)

I.57: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5176 (3,0); 7,2606 (31,9); 5,2993 (5,6); 4,1303 (5,2); 4,1137 (10,4); 4,0972 (5,2); 1,6820 (2,6); 1,6694 (7,3); 1,6615 (7,4); 1,6498 (3,0); 1,6213 (1,1); 1,6045 (3,5); 1,5871 (4,7); 1,5672 (4,2); 1,5495 (72,0); 1,3851 (0,7); 1,3666 (2,6); 1,3478 (4,3); 1,3372 (4,1); 1,3263 (9,9); 1,3178 (7,9); 1,3105 (3,3); 1,3056 (3,0); 1,2921 (0,7); 0,9210 (8,4); 0,9026 (16,0); 0,8842 (7,0); -0,0002 (36,9)

I.58: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4988 (1,3); 7,2608 (10,7); 5,2993 (2,3); 5,0501 (0,4); 5,0345 (1,1); 5,0189 (1,5); 5,0032 (1,1); 4,9876 (0,5); 1,6573 (1,2); 1,6447 (3,5); 1,6368 (3,6); 1,6252 (1,5); 1,5528 (22,6); 1,3289 (1,5); 1,3174 (3,6); 1,3094 (3,6); 1,2969 (1,3); 1,2246 (16,0); 1,2090 (16,0); -0,0002 (12,4)

I.59: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3705 (5,2); 7,2610 (33,0); 5,2126 (2,4); 5,1983 (4,3); 5,1921 (3,3); 5,1836 (2,4); 5,1775 (1,3); 1,8594 (1,0); 1,8442 (1,9); 1,8246 (3,5); 1,8086 (4,9); 1,7945 (3,6); 1,7696 (1,3); 1,6960 (5,0); 1,6880 (3,7); 1,6682 (10,6); 1,6479 (7,7); 1,6353 (16,0); 1,6275 (14,8); 1,6156 (7,5); 1,6029 (2,2); 1,5831 (4,2); 1,5749 (5,5); 1,5547 (66,8); 1,3600 (0,5); 1,3195 (5,5); 1,3080 (13,1); 1,3001 (12,4); 1,2875 (4,4); 1,2650 (0,6); 1,2507 (0,4); 1,2248 (0,4); 1,2091 (0,3); 0,8821 (0,4); -0,0002 (39,5)

I.60: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4310 (1,5); 7,2612 (6,7); 3,9090 (5,4); 3,8926 (5,4); 1,9470 (0,5); 1,9302 (1,0); 1,9136 (1,2); 1,8969 (1,0); 1,8803 (0,5); 1,6945 (1,3); 1,6819 (3,6); 1,6740 (3,6); 1,6624 (1,5); 1,5576 (10,4); 1,3479 (1,5); 1,3362 (3,7); 1,3283 (3,6); 1,3158 (1,2); 0,9083 (16,0); 0,8915 (15,5); -0,0002 (8,2)

I.61: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4127 (0,4); 7,2608 (2,0); 4,1342 (0,7); 4,1177 (1,4); 4,1011 (0,8); 4,0951 (0,4); 4,0785 (0,5); 2,0435 (0,4); 1,6840 (0,6); 1,6715 (1,2); 1,6635 (1,3); 1,6519 (0,7); 1,6274 (0,3); 1,6173 (0,4); 1,6108 (0,6); 1,5937 (0,8); 1,5734 (0,6); 1,3739 (0,5); 1,3550 (0,8); 1,3412 (1,0); 1,3302 (1,7); 1,3223 (2,4); 1,3044 (2,9); 1,2866 (4,0); 1,2653 (13,7); 0,9968 (0,4); 0,9888 (0,4); 0,9520 (0,4); 0,9335 (0,9); 0,9237 (1,3); 0,9148 (0,7); 0,9050 (3,4); 0,8987 (6,3); 0,8821 (16,0); 0,8644 (7,4); 0,8377 (0,4); -0,0002 (2,4)

I.62: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3719 (1,4); 7,2604 (19,0); 5,0552 (0,4); 5,0396 (1,1); 5,0240 (1,5); 5,0084 (1,1); 4,9929 (0,4); 1,6606 (1,2); 1,6482 (3,5); 1,6403 (3,6); 1,6286 (1,5); 1,5472 (38,5); 1,3307 (1,5); 1,3193 (3,7); 1,3113 (3,5); 1,2988 (1,2); 1,2311 (16,0); 1,2154 (15,8); -0,0002 (23,4)

I.63: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5419 (2,2); 7,5183 (0,4); 7,2599 (55,6); 7,2328 (0,4); 4,9283 (0,4); 4,7594 (16,0); 1,8045 (1,7); 1,7915 (5,2); 1,7834 (5,3); 1,7712 (2,2); 1,5810 (0,4); 1,5414 (77,9); 1,4929 (0,4); 1,4808 (0,4); 1,4386 (2,2); 1,4263 (5,7); 1,4184 (5,6); 1,4051 (2,1); 1,3657 (0,4); 1,3359 (1,4); 1,2840 (1,8); 1,2560 (10,3); 1,1844 (0,6); 1,1259 (0,4); 1,1051 (0,6); 1,0788 (0,4); 0,8812 (1,5); 0,8629 (1,0); 0,8452 (1,1); -0,0002 (68,6); -0,1496 (0,4)

I.64: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5341 (6,3); 7,2635 (6,2); 4,5225 (5,2); 4,5017 (15,8); 4,4809 (16,0); 4,4601 (5,4); 1,7878 (5,2); 1,7747 (15,0); 1,7668 (15,1); 1,7546 (6,2); 1,7144 (0,6); 1,5842 (8,3); 1,4709 (0,5); 1,4306 (6,3); 1,4184 (15,2); 1,4105 (15,0); 1,3973 (5,2); 1,3588 (0,3); 1,2636 (0,4); 0,8819 (0,4); -0,0002 (7,1)

I.65: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4672 (2,3); 7,2222 (9,8); 3,7612 (16,0); 1,9663 (2,7); 1,6302 (1,9); 1,6178 (5,5); 1,6098 (5,6); 1,5982 (2,3); 1,5156 (14,1); 1,2890 (2,4); 1,2775 (5,7); 1,2695 (5,6); 1,2569 (2,1); 1,2179 (1,5); 0,8433 (0,4); 0,1477 (0,4); -0,0002 (75,6); -0,0388 (11,9); -0,1510 (0,4)

I.66: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6344 (7,0); 7,5181 (0,6); 7,3779 (6,7); 7,3590 (14,4); 7,3385 (10,4); 7,2594 (77,3); 7,2354 (5,7); 7,2169 (8,1); 7,1982 (3,3); 7,0944 (13,3); 7,0918 (15,0); 7,0729 (13,1); 6,9956 (0,5); 5,2980 (0,9); 2,0040 (15,1); 1,9248 (0,3); 1,8870 (5,4); 1,8743 (15,6); 1,8663 (16,0); 1,8543 (6,6); 1,8142 (0,5); 1,5420 (148,4); 1,5147 (1,1); 1,4890 (6,6); 1,4771 (15,9); 1,4690 (16,0); 1,4562 (5,8); 1,4177 (0,4); 1,2570 (0,9); 0,8824 (0,5); 0,1457 (0,4); 0,0191 (0,4); -0,0002 (90,0); -0,1487 (0,5)

I.67: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,0466 (6,7); 3,8998 (12,7); 3,8880 (12,8); 3,3236 (16,0); 2,5136 (2,8); 2,5106 (6,0); 2,5076 (8,2); 2,5046 (5,9); 2,5017 (2,7); 1,4619 (3,1); 1,4539 (7,9); 1,4484 (8,7); 1,4410 (3,4); 1,1920 (3,8); 1,1845 (8,7); 1,1790 (9,0); 1,1710 (3,2); 1,0838 (0,5); 1,0798 (0,6); 1,0786 (0,6); 1,0759 (0,4); 1,0718 (1,2); 1,0706 (1,2); 1,0666 (1,2); 1,0642 (1,0); 1,0624 (0,9); 1,0586 (2,2); 1,0546 (0,9); 1,0530 (1,0); 1,0506 (1,3); 1,0466 (1,3); 1,0455 (1,3); 1,0414 (0,4); 1,0384 (0,7); 1,0375 (0,7); 1,0335 (0,5); 0,5044 (1,8); 0,4971 (5,7); 0,4942 (5,8); 0,4911 (2,6); 0,4872 (2,6); 0,4837 (5,8); 0,4808 (5,5); 0,4738 (2,0); 0,2679 (2,0); 0,2607 (6,5); 0,2582 (6,1); 0,2529 (5,8); 0,2503 (6,7); 0,2430 (1,7)

I.68: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5171 (5,9); 7,2626 (11,3); 5,0297 (1,0); 5,0198 (1,9); 5,0101 (2,9); 5,0003 (3,7); 4,9906 (3,0); 4,9808 (2,1); 4,9711 (1,1); 3,8385 (3,0); 3,8288 (3,8); 3,8227 (3,6); 3,8110 (5,4); 3,7995 (4,7); 3,7935 (4,8); 3,7839 (4,0); 3,5753 (4,0); 3,5669 (4,4); 3,5556 (4,7); 3,5468 (7,2); 3,5377 (4,0); 3,5265 (3,9); 3,5180 (3,6); 1,9362 (1,6); 1,9272 (3,1); 1,9199 (3,2); 1,9124 (3,2); 1,9037 (3,6); 1,8950 (4,2); 1,8871 (4,2); 1,8801 (4,2); 1,8710 (2,3); 1,6938 (5,8); 1,6816 (14,0); 1,6734 (16,0); 1,6620 (9,8); 1,6524 (4,3); 1,6402 (4,5); 1,6298 (3,8); 1,6202 (2,6); 1,6102 (2,1); 1,5783 (16,2); 1,3898 (0,4); 1,3495 (5,0); 1,3379 (12,2); 1,3299 (12,0); 1,3173 (4,5); 1,2787 (0,5); 1,2571 (0,4); -0,0002 (14,0)

I.69: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4894 (2,4); 7,2252 (2,7); 3,7603 (16,0); 1,6272 (2,0); 1,6147 (5,4); 1,6068 (5,6); 1,5951 (2,4); 1,5539 (4,3); 1,2858 (2,4); 1,2742 (5,6); 1,2662 (5,6); 1,2536 (2,1); 0,1476 (0,4); 0,0444 (0,4); 0,0422 (0,4); 0,0330 (0,3); -0,0002 (75,6); -0,0392 (3,8); -0,0475 (0,5); -0,0560 (0,4); -0,1511 (0,4)

I.70: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5028 (6,5); 7,2637 (10,8); 5,3836 (0,4); 5,0304 (1,1); 5,0208 (2,2); 5,0110 (3,2); 5,0013 (4,1); 4,9915 (3,2); 4,9818 (2,1); 4,9722 (1,0); 4,1921 (0,3); 3,8382 (3,4); 3,8285 (4,3); 3,8225 (4,1); 3,8105 (5,9); 3,7991 (5,1); 3,7934 (5,2); 3,7837 (4,2); 3,5762 (4,7); 3,5679 (5,0); 3,5565 (5,4); 3,5477 (8,0); 3,5387 (4,3); 3,5273 (4,2); 3,5190 (3,8); 1,9370 (1,9); 1,9282 (3,5); 1,9210 (3,6); 1,9138 (3,6); 1,9039 (4,0); 1,8951 (4,6); 1,8882 (4,6); 1,8813 (4,5); 1,8722 (2,3); 1,6962 (5,7); 1,6837 (15,7); 1,6757 (16,0); 1,6638 (10,1); 1,6520 (4,2); 1,6399 (4,6); 1,6295 (3,8); 1,6198 (2,3); 1,6097 (2,1); 1,5921 (15,3); 1,3939 (0,5); 1,3537 (5,8); 1,3419 (13,8); 1,3340 (13,2); 1,3214 (4,7); 1,2985 (0,6); 1,2812 (1,0); 1,2632 (0,7); 1,1647 (0,5); -0,0002 (13,4)

I.71: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0798 (6,5); 5,5610 (0,9); 5,5480 (3,4); 5,5350 (5,2); 5,5220 (3,5); 5,5089 (0,9); 3,3935 (4,2); 3,3906 (2,3); 3,3800 (7,2); 3,3770 (8,1); 3,3665 (3,2); 3,3636 (6,0); 3,3231 (16,0); 3,3002 (6,0); 3,2972 (3,3); 3,2874 (7,7); 3,2840 (6,4); 3,2740 (2,3); 3,2710 (4,2); 2,5137 (4,3); 2,5107 (9,2); 2,5077 (12,6); 2,5047 (9,1); 2,5017 (4,3); 1,4960 (3,2); 1,4878 (8,0); 1,4823 (8,7); 1,4748 (3,4); 1,2499 (0,4); 1,2409 (0,4); 1,2234 (3,6); 1,2158 (8,2); 1,2103 (8,4); 1,2021 (3,0)

I.72: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5661 (2,1); 7,2608 (12,0); 4,7583 (16,0); 2,0061 (1,4); 1,8020 (1,7); 1,7889 (4,9); 1,7809 (4,9); 1,7686 (2,1); 1,5524 (17,0); 1,4356 (2,1); 1,4233 (5,1); 1,4153 (5,0); 1,4022 (1,8); 1,2843 (0,4); 1,2564 (2,0); 0,8821 (0,6); 0,8638 (0,3); -0,0002 (14,2)

I.73: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6574 (8,2); 7,3749 (6,8); 7,3551 (14,8); 7,3356 (10,5); 7,2587 (10,0); 7,2321 (5,4); 7,2136 (8,0); 7,1950 (3,2); 7,0905 (15,8); 7,0713 (13,3); 1,9208 (0,4); 1,8818 (5,4); 1,8690 (15,4); 1,8612 (16,0); 1,8492 (6,3); 1,8090 (0,5); 1,5668 (4,8); 1,5235 (0,6); 1,4834 (6,4); 1,4714 (15,7); 1,4636 (15,9); 1,4508 (5,5); 1,4118 (0,3); 1,2550 (0,8); -0,0002 (12,9)

I.74: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5486 (6,2); 7,2611 (16,9); 4,5211 (5,3); 4,5003 (15,9); 4,4795 (16,0); 4,4587 (5,4); 1,7866 (5,2); 1,7736 (14,9); 1,7657 (14,6); 1,7534 (6,0); 1,7134 (0,6); 1,5548 (8,9); 1,4673 (0,5); 1,4270 (6,4); 1,4148 (15,0); 1,4069 (14,6); 1,3937 (5,2); 1,3551 (0,3); 1,2649 (0,7); 0,8821 (0,6); -0,0002 (22,9)

I.75: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4958 (2,1); 7,2611 (11,6); 5,6817 (0,4); 5,6617 (1,4); 5,6421 (2,2); 5,6222 (1,5); 5,6026 (0,4); 3,4671 (1,6); 3,4429 (3,2); 3,4221 (2,1); 3,3034 (2,4); 3,2839 (3,4); 3,2796 (3,0); 3,2597 (1,8); 2,0064 (16,0); 1,6947 (1,6); 1,6819 (4,4); 1,6739 (4,6); 1,6621 (1,9); 1,5514 (6,0); 1,3506 (1,9); 1,3387 (4,6); 1,3308 (4,6); 1,3180 (1,7); 1,2549 (0,6); -0,0002 (15,2)

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

δ = 7,2997 (5,8); 5,3391 (1,0); 4,1328 (5,2); 4,1187 (0,5); 4,1110 (5,2); 2,9515 (0,4); 2,1210 (0,4); 2,0987 (0,8); 2,0764 (1,1); 2,0542 (0,9); 2,0319 (0,5); 1,5936 (5,3); 1,4701 (0,6); 1,0596 (0,5); 1,0425 (16,0); 1,0201 (15,3); 1,0031 (0,8); 0,9866 (0,5); 0,9806 (0,8); 0,9727 (1,8); 0,9645 (0,5); 0,9504 (1,7); 0,1085 (0,7); 0,0376 (5,6)

II.a.02: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2672 (1,2); 4,4055 (2,5); 4,3912 (7,7); 4,3769 (7,8); 4,3627 (2,6); 2,0088 (0,9); 1,4065 (8,0); 1,3922 (16,0); 1,3780 (8,0); 1,2628 (0,4); 1,2538 (1,0); -0,0002 (1,4)

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

δ = 7,6041 (0,4); 7,2984 (2,1); 3,9506 (16,0); 3,9244 (1,2); 1,5852 (1,8); 0,0364 (2,4)

II.a.04: ^1H -NMR(499,9 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 15,1027 (0,3); 14,9975 (0,4); 14,9759 (0,4); 14,9509 (0,4); 14,9312 (0,4); 14,8896 (0,4); 14,8671 (0,5); 14,8450 (0,5); 14,7865 (0,6); 14,7539 (0,7); 14,6142 (1,0); 14,5943 (1,2); 14,5485 (1,4); 14,5271 (1,5); 14,5236 (1,5); 14,2968 (4,7); 14,1541 (7,0); 14,0699 (5,8); 13,9449 (3,2); 13,8394 (2,0); 13,5699 (0,8); 13,5440 (0,8); 13,4921 (0,6); 13,4731 (0,6); 13,4502 (0,6); 13,4216 (0,6); 13,3628 (0,5); 13,3451 (0,5); 13,3306 (0,4); 13,2703 (0,5); 13,2252 (0,4); 13,2010 (0,4); 13,1591 (0,4); 13,1269 (0,3); 13,0464 (0,3); 7,7544 (8,9); 7,4284 (1,4); 4,5359 (0,3); 4,4060 (0,3); 4,3940 (0,3); 4,3632 (0,4); 4,3500 (0,4); 4,3401 (0,4); 4,2742 (0,4); 4,2369 (0,4); 4,2278 (0,5); 4,2094 (0,5); 4,1782 (0,5); 4,1293 (0,5); 4,1189 (0,6); 4,1132 (0,6); 4,1025 (0,6); 4,0515 (0,6); 4,0446 (0,7); 4,0191 (0,7); 3,9836 (0,8); 3,9763 (0,8); 3,9301 (0,9); 3,8612 (1,0); 3,4109 (6,4); 3,3496 (7,0); 3,1621 (3,7); 2,8672 (1,0); 2,8488 (1,0); 2,8394 (0,9); 2,8120 (0,8); 2,8052 (0,8); 2,7588 (0,9); 2,7233 (0,7); 2,7027 (0,7); 2,6458 (1,7); 2,6421 (2,1); 2,6172 (0,7); 2,5952 (0,7); 2,5818 (0,7); 2,5143 (96,0); 2,5108 (196,0); 2,5072 (264,8); 2,5037 (189,8); 2,5002 (88,3); 2,3720 (1,1); 2,3683 (1,6); 2,3644 (1,2); 2,1856 (0,5); 2,0896 (16,0); 2,0780 (0,4); 1,9135 (0,5); 1,3579 (3,0); 1,3421 (1,0); 1,3177 (0,4); 1,3006 (1,0); 1,2736 (0,5); 1,2600 (1,1); 1,2307 (1,5); 1,2053 (0,4); 1,1833 (2,4); 1,1716 (1,1); 1,0969 (0,4); 0,8541 (0,5)

II.a.05: ^1H -NMR(499,9 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 3,8598 (16,0); 3,3560 (0,5); 2,5322 (0,6); 2,5288 (1,2); 2,5253 (1,7); 2,5217 (1,2); 2,5184 (0,6)

II.a.06: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2983 (1,3); 3,9521 (16,0); 1,5875 (0,4); 0,0350 (1,7)

II.a.07: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 19,6514 (1,2); 19,4242 (1,2); 14,4211 (1,5); 14,2144 (4,5); 14,0488 (9,5); 13,9419 (4,6); 13,7837 (1,7); 13,6736 (1,2); 13,6487 (1,2); 13,5662 (1,3); 9,3511 (1,3); 5,7749 (3,0); 4,0838 (1,6); 4,0599 (3,6); 4,0367 (3,6); 4,0129 (1,4); 3,7199 (1,5); 3,6986 (1,4); 3,6881 (1,6); 3,6447 (2,0); 3,5905 (2,2); 3,5604 (2,8); 3,3605 (11,6); 3,1076 (1,9); 3,0934 (1,9); 3,0852 (2,0); 3,0078 (1,6); 2,9717 (1,3); 2,9121 (1,4); 2,8858 (1,6); 2,7479 (1,7); 2,5339 (95,7); 2,5278 (198,8); 2,5217 (271,4); 2,5157 (195,8); 2,5096 (91,8); 2,4429 (1,8); 2,4204 (1,3); 2,2912 (2,1); 2,0080 (16,0); 1,2510 (7,5); 1,2177 (5,6); 1,1940 (10,0); 1,1702 (5,6); 0,8674 (1,7); 0,8481 (1,5); 0,8110 (1,2); 0,0286 (13,0); 0,0178 (337,9); 0,0069 (13,0); -0,0500 (1,4); -0,1807 (1,7)

II.a.08: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2630 (2,8); 4,4029 (2,5); 4,3887 (7,6); 4,3744 (7,7); 4,3601 (2,6); 2,0073 (0,6); 1,5552 (2,0); 1,4026 (8,0); 1,3883 (16,0); 1,3740 (7,8); 1,2543 (0,5); -0,0002 (3,2)

II.a.09: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2606 (15,4); 5,2995 (3,1); 4,3996 (2,5); 4,3853 (7,7); 4,3710 (7,8); 4,3568 (2,6); 1,5458 (28,2); 1,3998 (8,0); 1,3856 (16,0); 1,3713 (7,9); 1,2560 (0,6); -0,0002 (15,9)

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

δ = 8,7327 (3,0); 8,0481 (4,2); 8,0381 (4,2); 4,0875 (2,4); 4,0699 (7,4); 4,0521 (7,5); 4,0344 (2,5); 3,3389 (56,6); 2,5269 (0,4); 2,5132 (10,1); 2,5092 (19,6); 2,5048 (25,0); 2,5004 (18,0); 2,0758 (0,7); 1,4499 (2,0); 1,4377 (5,5); 1,4294 (5,9); 1,4184 (2,4); 1,2993 (0,5); 1,2594 (0,8); 1,2393 (2,1); 1,1964 (2,6); 1,1853 (5,8); 1,1770 (5,5); 1,1644 (2,4); 1,1592 (8,1); 1,1415 (16,0); 1,1237 (7,7); 0,8535 (0,5); -0,0002 (0,8)

IVb.01: ¹H-NMR(400,2 MHz, d6-DMSO):

δ= 8,7731 (2,4); 8,3151 (5,0); 7,4172 (7,9); 4,0894 (2,1); 4,0717 (6,7); 4,0540 (6,7); 4,0362 (2,1); 3,3267 (10,3); 3,3026 (1,5); 2,5254 (0,4); 2,5206 (0,6); 2,5119 (7,7); 2,5075 (15,6); 2,5029 (20,3); 2,4983 (14,5); 2,4937 (6,9); 1,4457 (1,8); 1,4334 (4,4); 1,4251 (4,8); 1,4141 (2,0); 1,1822 (2,0); 1,1689 (9,3); 1,1629 (4,4); 1,1510 (16,0); 1,1333 (7,0); -0,0002 (2,4)

IVb.02: ¹H-NMR(600,1 MHz, d6-DMSO):

δ= 8,8939 (2,0); 8,3116 (3,7); 7,4235 (0,4); 7,4075 (5,4); 4,0887 (1,3); 4,0768 (4,0); 4,0722 (0,5); 4,0650 (4,0); 4,0604 (0,5); 4,0532 (1,3); 3,3325 (5,2); 3,3283 (15,0); 3,3245 (16,0); 3,3010 (1,0); 2,5086 (4,3); 2,5057 (9,0); 2,5027 (12,2); 2,4997 (8,6); 2,4969 (3,9); 1,4368 (1,2); 1,4289 (3,1); 1,4234 (3,3); 1,4160 (1,3); 1,1846 (4,4); 1,1727 (9,2); 1,1609 (4,6); 1,1528 (1,5); 1,1453 (3,2); 1,1398 (3,1); 1,1319 (1,1)

IVb.03: ¹H-NMR(400,1 MHz, CDCl₃):

δ= 7,2597 (13,8); 6,8664 (10,0); 6,7007 (2,6); 6,6837 (2,5); 4,1866 (2,9); 4,1703 (8,0); 4,1524 (7,9); 4,1350 (2,7); 2,9545 (0,4); 2,8817 (0,3); 1,6436 (10,4); 1,5880 (0,4); 1,5423 (10,2); 1,3280 (0,4); 1,2719 (10,7); 1,2483 (9,0); 1,2302 (16,0); 1,2127 (8,0); -0,0002 (17,6)

IVb.05: ¹H-NMR(400,2 MHz, d6-DMSO):

δ= 8,8497 (3,1); 7,4168 (8,3); 4,0937 (1,8); 4,0759 (5,5); 4,0582 (5,5); 4,0405 (1,8); 3,3552 (20,7); 3,3478 (40,9); 2,5097 (15,5); 2,5053 (19,3); 2,5009 (14,6); 1,4464 (1,6); 1,4343 (4,3); 1,4261 (4,7); 1,4152 (2,1); 1,2400 (1,0); 1,1799 (6,2); 1,1722 (3,0); 1,1621 (16,0); 1,1531 (5,7); 1,1444 (6,7); -0,0002 (0,5)

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

δ = 7,4521 (2,4); 7,4385 (2,6); 7,4336 (2,6); 7,4201 (2,4); 7,2982 (6,6); 6,8863 (4,0); 6,8853 (3,8); 6,8679 (4,1); 6,8326 (0,8); 4,2365 (2,4); 4,2127 (7,4); 4,1890 (7,6); 4,1653 (2,5); 1,7130 (2,0); 1,6964 (5,8); 1,6855 (5,9); 1,6704 (2,6); 1,6281 (6,3); 1,6174 (0,4); 1,3423 (2,7); 1,3272 (6,0); 1,3163 (6,1); 1,2996 (2,6); 1,2915 (8,3); 1,2677 (16,0); 1,2440 (7,7); 0,9161 (0,4); 0,0340 (6,6)

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

δ = 7,3382 (10,3); 7,3044 (7,9); 6,7676 (2,0); 4,2423 (2,4); 4,2185 (7,5); 4,1947 (7,6); 4,1710 (2,5); 2,8481 (4,7); 1,7064 (2,0); 1,6896 (5,6); 1,6789 (5,8); 1,6635 (2,5); 1,6420 (3,4); 1,3285 (2,7); 1,3132 (6,2); 1,2986 (9,4); 1,2856 (2,5); 1,2747 (16,0); 1,2509 (7,6); 0,0405 (8,1)

V.02: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2919 (4,7); 7,2623 (3,9); 6,7012 (1,2); 5,0384 (0,4); 5,0259 (1,1); 5,0134 (1,5); 5,0009 (1,2); 4,9885 (0,5); 1,6259 (1,1); 1,6160 (3,3); 1,6098 (3,4); 1,6003 (1,4); 1,5902 (7,5); 1,2665 (1,5); 1,2572 (3,9); 1,2510 (3,8); 1,2410 (1,3); 1,2203 (16,0); 1,2078 (16,0); -0,0002 (3,6)

V.03: $^1\text{H-NMR}$ (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)

V.04: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $d_6\text{-DMSO}$):

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)

V.05: $^1\text{H-NMR}$ (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)

XI.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)

XIIa.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)

XIII.01: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2626 (1,0); 5,7182 (0,9); 3,8289 (16,0); 1,5821 (0,5); -0,0002 (1,1)

XIII.02: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

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)

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

$\delta = 8,0902$ (0,4); $7,2984$ (6,7); $3,9068$ (16,0); $2,2651$ (12,6); $1,5989$ (5,4); $0,1070$ (0,6); $0,0362$ (6,1)

XIV.02: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $d_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,9025$ (1,1); $8,0098$ (0,7); $3,3874$ (0,6); $3,3540$ (0,6); $3,3136$ (0,5); $2,5463$ (8,0); $2,5404$ (17,3); $2,5344$ (24,4); $2,5284$ (17,8); $2,5226$ (8,5); $2,0407$ (16,0); $1,9413$ (0,4); $1,2066$ (0,4); $0,0431$ (0,8); $0,0322$ (28,2); $0,0211$ (1,1)

Dữ liệu sinh học - Các hợp chất có công thức (I)

Ví dụ A được mô tả dưới đây thể hiện sự cảm ứng sự biểu hiện gen phòng thủ ở *Arabidopsis thaliana* bởi các hợp chất có công thức (I), đặc biệt là sự kích thích con đường axit salixylic. Do đó, các hợp chất này có thể cảm ứng sự phòng thủ của vật chủ và do đó bảo vệ thực vật chống lại nhiều loại mầm bệnh bao gồm vi khuẩn và nấm.

Ví dụ B, C và D được mô tả dưới đây thể hiện thử nghiệm tế bào *in vitro* hướng đến tính bất hoạt của các hợp chất có công thức (I) chống lại nhiều loại mầm bệnh khác nhau bao gồm vi khuẩn và nấm, do đó minh họa chế độ hợp chất của các hợp chất có công thức (I) ở dạng chất cảm ứng sự phòng thủ của vật chủ thực vật.

Ví dụ E, F, G, H và I được mô tả dưới đây thể hiện hoạt tính *in vivo* của các hợp chất ở thực vật có công thức (I) bằng cách kích thích sự phóng thủ thực vật chống lại nhiều loại mầm bệnh hại thực vật bao gồm vi khuẩn và nấm.

Ví dụ J, K, L, M và N được mô tả dưới đây thể hiện các ví dụ so sánh của hoạt tính *in vivo* ở thực vật của các hợp chất được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692 so với các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế.

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

Thực vật chỉ 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 salixylat của 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 phát 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 giả được đặt là 1,00. Việc xử lý bằng axit salixylic (300ppm) dẫn đến giá trị phát huỳnh quang tương đối là 2,70, chứng tỏ tính hợp lệ của hệ thống thử nghiệm.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện giá trị phát huỳnh quang tương đối ít nhất là trên 2 ở nồng độ hợp chất là 300 ppm: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.18; I.20; I.21; I.22; I.23; I.24; I.25; I.26; I.27; I.28; I.29; I.30; I.31; I.32; I.33; I.34; I.36; I.37; I.38; I.39; I.40; I.41; I.42; I.44; I.45.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện giá trị phát huỳnh quang tương đối ít nhất là trên 2 ở nồng độ hợp chất là 75 ppm: I.02; I.03; I.05; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.15; I.16; I.17; I.18; I.20; I.23; I.24; I.28; I.29; I.31; I.32; I.33; I.34; I.36; I.37; I.42; I.45. Salixylat là hormon phòng thủ chính chống lại các mầm bệnh thực vật. Tất cả các hợp chất được mô tả trên đây kích thích con đường axit salixylic và do đó có thể bảo vệ thực vật chống lại nhiều loại mầm bệnh.

Ví dụ B: Thử nghiệm tế bào *in vitro* ở *Pseudomonas syringae* pv. *tomato*

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: 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 $\leq 1\%$.

Chủng cấy được điều chế từ sản phẩm 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 khi ủ trong 24 giờ, hiệu lực của hợp chất được xác định bằng cách đo phổ sinh 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 (hiệu quả thấp hơn hoặc bằng 30%) tại nồng độ 20 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

Ví dụ C: Thử nghiệm tế bào *in vitro* ở *Botrytis cinerea*

Dung môi: DMSO

Môi trường nuôi cấy: 14,6g D-glucosa khan (VWR), 7,1g pepton nấm (Oxoid), 1,4g chất chiết nấm men hạt (Merck), QSP 1 lít

Chủng cấy: Huyền phù bào tử

Các chất diệt nấm được hòa tan trong DMSO và dung dịch này được sử dụng để điều chế khoảng nồng độ mong muốn. Nồng độ cuối cùng của DMSO được sử dụng trong thử nghiệm này là $\leq 1\%$.

Huyền phù bào tử của *B. cinerea* được chuẩn bị và pha loãng tới mật độ bào tử mong muốn.

Các chất diệt nấm được đánh giá về khả năng ức chế của chúng đối với sự nảy mầm của bào tử và sự phát triển của sợi nấm trong thử nghiệm nuôi cấy lỏng. Các hợp chất được bổ sung với nồng độ mong muốn vào môi trường nuôi cấy chứa bào tử. Sau 5 ngày ủ, độc tính kháng nấm của các hợp chất được xác định bằng các xác định phổ phát triển của sợi nấm. Khả năng ức chế sự phát triển của nấm được xác định bằng cách so sánh các giá trị độ hấp thụ trong các giếng chứa chất diệt nấm với độ hấp thụ trong các giếng đối chứng không chứa chất diệt nấm.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện không có hoạt tính trực tiếp (hiệu quả thấp hơn hoặc bằng 30%) tại nồng độ 20 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

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

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: Huyền phù vi khuẩn

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

Chủng cấy được điều chế từ sản phẩm 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 khi ủ trong 24 giờ, hiệu lực của hợp chất được xác định bằng cách đo phổ sinh 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 các thành phần hoạt tính.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện không có hoạt tính trực tiếp (hiệu quả thấp hơn hoặc bằng 30%) tại nồng độ 20 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

Ví dụ E: thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (đốm ví dụ trên cà chua)

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

Cây cà chua con được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được điều chế như đã mô tả ở trên, Các cây đối chứng được xử lý chỉ với dung dịch nước của axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, thực vật được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước của vi khuẩn *Pseudomonas syringae* pv. *tomato*. Các cây cà chua đã gây nhiễm được ủ trong 4 ngày trong khí quyển bão hòa tại 22°C ngày / 20°C đêm - 70%HR và sau đó trong 1 hoặc 2 ngày tại 22°C ngày / 20°C đêm tại độ ẩm tương đối 70-80%.

Thử nghiệm được đánh giá 5 đến 6 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 sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.01.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.09.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.07; I.09; I.11; I.12; I.15; I.26.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.03; I.16; I.21; I.22; I.25; I.33; I.37; I.45.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.10; I.17; I.23; I.24; I.40.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.03; I.09; I.25; I.33; I.39; I.43.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.12; I.14; I.20; I.34; I.36; I.45.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.10; I.11; I.15; I.16; I.17; I.18; I.21; I.22.

Ví dụ F: thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Peronospora parasitica* (bệnh sương mai Crucifer)

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

Cây cải bắp con được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được điều chế như đã mô tả ở trên, Các cây đối chứng được xử lý chỉ với dung dịch nước của axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, thực vật được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước chứa các bào tử *Peronospora parasitica*. Các cây cải bắp đã gây nhiễm được ủ trong thời gian 5 ngày ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 100%.

Thử nghiệm được đánh giá 5 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 sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.04; I.26

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.10; I.14; I.17; I.33

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.09; I.13; I.15; I.23; I.28

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.03

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.12; I.31; I.35; I.44

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.09; I.10; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.23; I.26; I.28; I.29; I.30; I.33; I.38; I.40; I.42

Ví dụ G: thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Uromyces appendiculatus* (bệnh gỉ sắt trên đậu)

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

Cây đậu non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được điều chế như đã mô tả ở trên. Các cây đối chứng được xử lý chỉ với dung dịch nước của axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, thực vật được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước chứa các bào tử *Uromyces appendiculatus*. Thực vật đậu đã gây nhiễm được ủ trong 24 giờ ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 100% và sau đó, trong 9 ngày ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 70- 80%.

Thử nghiệm được đánh giá 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 sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.03; I.05.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.09.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.01; I.02.

Ví dụ H: Thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (Bệnh thán thư trên đậu)

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

Cây đậu non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được điều chế như đã mô tả ở trên. Các cây đối chứng được xử lý chỉ với dung dịch nước của axeton/Dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, cây được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước chứa các bào tử *Colletotrichum lindemuthianum*. Thực vật đậu đã gây nhiễm được ủ trong 24 giờ ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 100% và sau đó, trong 5 ngày ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 90%.

Thử nghiệm được đánh giá 6 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 sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.04.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.09.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 500 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.03.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.04; I.10; I.31; I.42.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.14; I.15; I.33.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.13.

Ví dụ I: thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* (bệnh thối đen trên cải bắp)

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

Cây cải bắp con được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được điều chế như đã mô tả ở trên, Các cây đối chứng được xử lý chỉ với dung dịch nước của 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 sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 70% đến 79% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.02; I.03; I.15; I.31; I.38; I.44.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 80% đến 89% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.23; I.30; I.45.

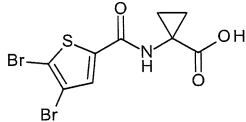
Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế sau thể hiện hiệu lực nằm trong khoảng từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm của thành phần hoạt tính: I.10; I.12; I.14; I.17; I.24; I.25; I.26; I.29; I.33; I.34; I.36; I.42.

Ví dụ J: các ví dụ so sánh

Hợp chất CMP1, được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (bệnh đốm vi khuẩn trên cà chua) trên cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ E.

Hợp chất CMP1 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 500 ppm	Hiệu quả (%) tại 125 ppm
CMP 1		0	0

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP1 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 500 ppm.

Cụ thể hơn, các hợp chất I.02 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 90% tại nồng độ là 500 ppm trong khi CMP1 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

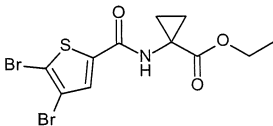
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP1 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 125 ppm.

Cụ thể hơn, hợp chất I.14 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất 80% tại nồng độ là 125 ppm trong khi CMP1 được chứng minh là thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

Hợp chất CMP2, được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (bệnh đốm vi khuẩn trên cà chua) trên cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ E.

Hợp chất CMP2 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 125 ppm
CMP2		0

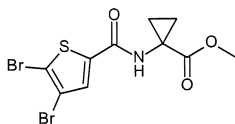
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP2 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 125 ppm.

Cụ thể hơn, các hợp chất I.01, I.43 và I.09 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 70% tại nồng độ là 125 ppm trong khi CMP2 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

Hợp chất CMP3, được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (bệnh đốm vi khuẩn trên cà chua) trên cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ E.

Hợp chất CMP3 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 31 ppm
CMP3		3

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP3 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 31 ppm.

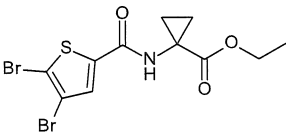
Cụ thể hơn, các hợp chất I.07, I.10, I.11 và I.16 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 70% tại nồng độ là 31 ppm trong khi CMP3 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

Ví dụ K: các ví dụ so sánh

Hợp chất CMP2 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Peronospora parasitica* (bệnh sương mai Crucifer) trong cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ F.

Hợp chất CMP2 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 31 ppm
CMP2		0

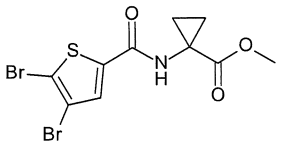
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với các hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP2 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 31 ppm.

Cụ thể hơn, các hợp chất I.01 và I.09 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 70% tại nồng độ là 31 ppm trong khi CMP2 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

Hợp chất CMP3 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Peronospora parasitica* (bệnh sương mai Crucifer) trong cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ F.

Hợp chất CMP3 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 125 ppm
CMP3		38

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với các hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP3 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 125 ppm.

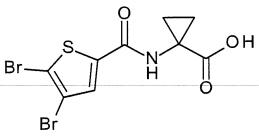
Cụ thể hơn, các hợp chất I.10 và I.16 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 90% tại nồng độ là 125 ppm trong khi CMP3 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 40% tại cùng nồng độ.

Ví dụ L: các ví dụ so sánh

Hợp chất CMP1 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (Bệnh thán thư trên đậu) trong cùng điều kiện như được mô tả trong Ví dụ H.

Hợp chất CMP1 được điều chế theo bộ lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 31 ppm
CMP1		27*

*trung bình số học của 2 thử nghiệm

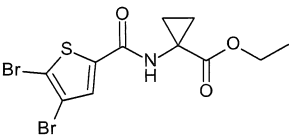
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP1 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 31 ppm.

Cụ thể hơn, các hợp chất I.02, I.13 và I.14 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất là 80% tại nồng độ là 31 ppm trong khi CMP1 được chứng minh là thể hiện hiệu quả thấp hơn 30% tại cùng nồng độ.

Hợp chất CMP2 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (Bệnh thán thư trên đậu) trong cùng điều kiện như được mô tả trong Ví dụ I.

Hợp chất CMP2 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 500 ppm
CMP2		0

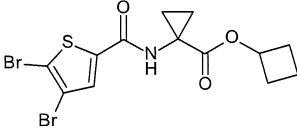
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP2 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 500 ppm.

Cụ thể hơn, hợp chất I.09 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất 80% tại nồng độ là 500 ppm trong khi CMP2 được chứng minh là thấp hơn 10% tại cùng nồng độ.

Hợp chất CMP5 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (Bệnh thán thư trên đậu) trong cùng điều kiện như được mô tả trong Ví dụ I.

Hợp chất CMP5 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 31 ppm
CMP5		25

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP5 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 31 ppm.

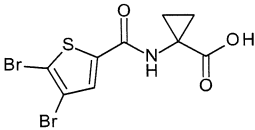
Cụ thể hơn, hợp chất I.42 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất 70% tại nồng độ là 31 ppm trong khi CMP5 được chứng minh là thấp hơn 30% tại cùng nồng độ.

Ví dụ M: các ví dụ so sánh

Hợp chất CMP1 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* (bệnh thối đen trên cải bắp) trong cùng các điều kiện như được mô tả trong Ví dụ I.

Hợp chất CMP1 được điều chế theo bộc lộ của WO2004/024692.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu quả (%) tại 31 ppm
CMP1		10*

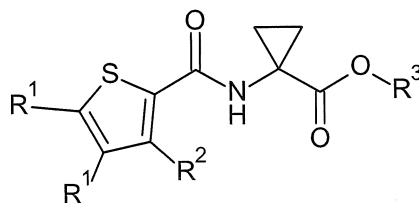
*trung bình số học của 2 thử nghiệm

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được chứng minh là thể hiện hiệu quả tốt hơn so với các hợp chất liên quan về mặt cấu trúc CMP1 khi được thử nghiệm tại nồng độ là 31 ppm.

Cụ thể hơn, hợp chất I.14 được chứng minh là thể hiện hiệu quả ít nhất 80% tại nồng độ là 31 ppm trong khi CMP1 được chứng minh là 10% tại cùng nồng độ.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):



(I)

trong đó:

R^1 là nguyên tử brom hoặc nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

R^3 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl, và nếu cả R^1 và R^2 đều là nguyên tử brom, thì R^3 được chọn từ nhóm bao gồm 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, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl, và nếu R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl, thì R_2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom và nguyên tử iot;

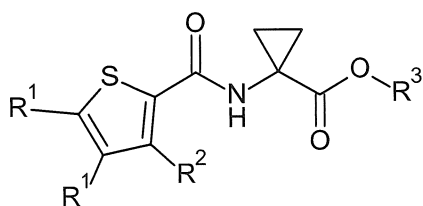
với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R^1 là các nguyên tử clo.

3. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R^1 là các nguyên tử brom.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo và nguyên tử brom.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó R^1 là khác với R^2 .
6. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom.
7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6, trong đó R^3 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, aralkyl và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl, và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.
8. Phương pháp kiểm soát nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên cây hoặc các bộ phận của cây bao gồm bước áp dụng hợp chất có công thức (I):



(I)

trong đó

R^1 là các nguyên tử brom hoặc các nguyên tử clo;

R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử brom, nguyên tử clo, nguyên tử iot và nguyên tử flo;

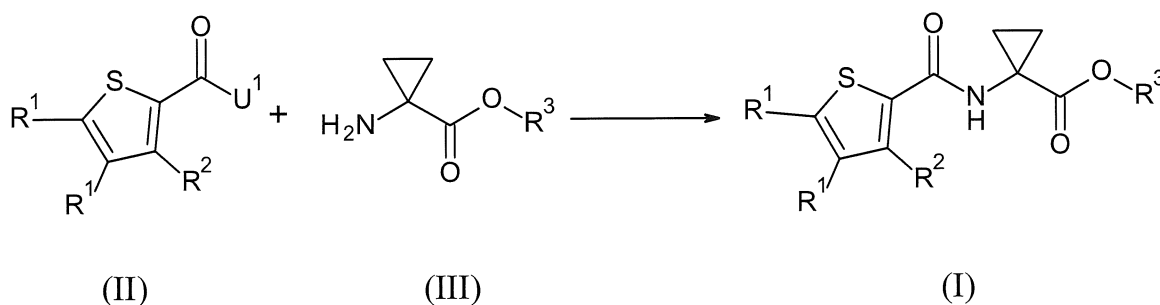
R^3 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, heteroaryl, aralkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và $-C_1$ - C_6 -alkyl-xyclopropyl;

với điều kiện là R^2 không phải là nguyên tử clo khi R^1 là các nguyên tử clo;

trong bảo vệ thực vật.

9. Phương pháp theo điểm 8, trong đó R^1 là các nguyên tử clo.

10. Phương pháp theo điểm 8, trong đó R^1 là các nguyên tử brom.
11. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 8 đến 10, trong đó R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo và nguyên tử brom.
12. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 8 đến 11, trong đó R^1 là khác với R^2 .
13. Phương pháp theo điểm 8, trong đó R^1 là các nguyên tử clo và R^2 được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử flo và nguyên tử clo.
14. Phương pháp theo điểm 8, trong đó R^1 là các nguyên tử clo và R^2 là nguyên tử brom.
15. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 8 đến 14, trong đó R^3 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, heteroaryl, aralkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-heteroaryl, heteroxyclyl có 4, 5 hoặc 6 cạnh, - C_1 - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl) $_3$ và - C_1 - C_6 -alkyl-xyclopropyl và tốt hơn là 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, và tốt nhất là được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử hydro và C_1 - C_6 -alkyl.
16. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) như được nêu trong điểm 1 bao gồm bước cho hợp chất có công thức (II) hoặc muối của nó phản ứng với hợp chất có công thức (III) hoặc muối của nó để thu được hợp chất có công thức (I):

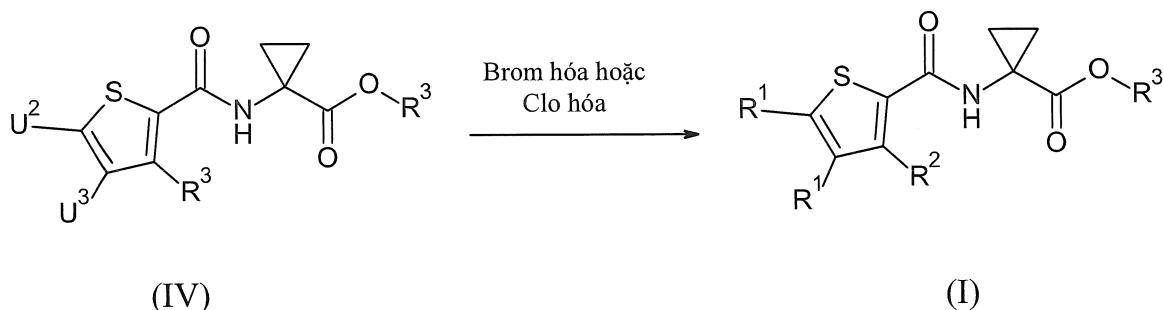


trong đó

R^1 , R^2 và R^3 là như được nêu trong điểm 1; và

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

17. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) như được nêu trong điểm 1 bao gồm bước tiến hành quá trình brom hóa hoặc clo hóa hợp chất có công thức (IV) hoặc muối của nó để thu được hợp chất có công thức (I):



trong đó

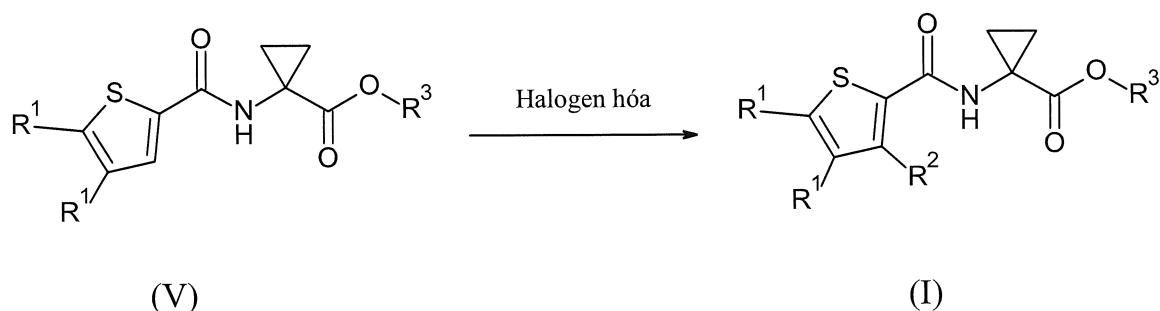
R^1 , R^2 và R^3 là như được nêu trong điểm 1;

U^2 là nguyên tử hydro, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom; và

U^3 là nguyên tử hydro, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom;

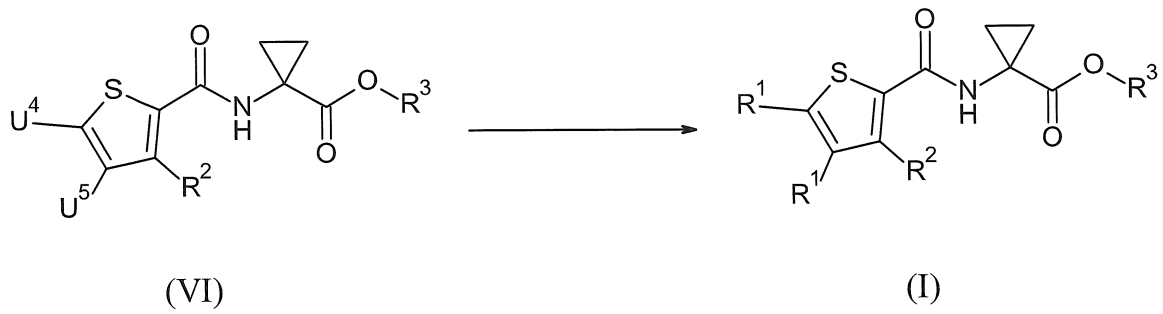
với điều kiện là ít nhất một trong số U^2 hoặc U^3 là nguyên tử hydro.

18. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) như được nêu trong điểm 1 bao gồm bước tiến hành quá trình halogen hóa hợp chất có công thức (V) để thu được hợp chất có công thức (I):



trong đó R^1 , R^2 và R^3 là như được nêu trong điểm 1.

19. Quy trình điều chế hợp chất có công thức (I) như được nêu trong điểm 1 bao gồm bước tiến hành quá trình diazo hóa hợp chất có công thức (VI) hoặc muối của nó sau đó là quá trình thế thiom để thu được hợp chất có công thức (I):



trong đó

R^1 , R^2 và R^3 là như được nêu trong điểm 1;

U^4 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom; và

U^5 là nhóm amino, nguyên tử clo hoặc nguyên tử brom;

với điều kiện là ít nhất một trong số U^4 hoặc U^5 là nhóm amino.

20. Chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 và ít nhất một chất mang thích hợp trong nông nghiệp.