



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

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

(11)



1-0047580

(51)^{2021.01} C07D 413/04; A01N 43/76

(13) B

(21) 1-2022-03640

(22) 17/12/2020

(86) PCT/EP2020/086759 17/12/2020

(87) WO2021/122986 24/06/2021

(30) 19218685.6 20/12/2019 EP

(45) 25/06/2025 447

(43) 26/09/2022 414A

(73) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany

(72) DUFOUR, Jeremy (FR); KNOBLOCH, Thomas (FR); BRUNET, Stephane (FR);
LAMPRECHT, Sybille (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) THIENYLOXAZOLON VÀ CÁC CHẤT TƯƠNG TỰ, CHẾ PHẨM CHỨA HỢP
CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ CÁC BỆNH DO VI KHUẨN
VÀ/HOẶC NẤM Ở THỰC VẬT

(21) 1-2022-03640

(57) Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất thiophen carboxamit được thế, mà hữu ích trong việc phòng trừ các vi sinh vật gây bệnh thực vật. Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất này và phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm ở thực vật.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất thiophen carboxamit được thể, việc sử dụng chúng để phòng trừ các vi sinh vật gây bệnh thực vật và chế phẩm chứa chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Mặc dù một số tác nhân diệt vi sinh vật đã được phát triển cho đến nay, vẫn còn nhu cầu phát triển các hợp chất diệt vi sinh vật mới để đáp ứng những yêu cầu về kinh tế và môi trường đang gia tăng hơn bao giờ hết về các tác nhân và chế phẩm bảo vệ cây trồng trong thời hiện đại. Những nhu cầu này bao gồm, chẳng hạn, phát triển phổ hoạt động, profin an toàn, tính chọn lọc, tỷ lệ áp dụng, sự tạo thành lượng tồn dư, và khả năng điều chế có lợi. Cũng có thể mong muốn có được các hợp chất mới để ngăn ngừa sự xuất hiện tính kháng thuốc.

Sáng chế đề xuất các hợp chất mới có ưu điểm vượt trội hơn các hợp chất và chế phẩm đã biết ít nhất về một số trong số những khía cạnh này.

Đơn PCT/EP2019/067824 chưa công bố mô tả các dẫn xuất thiophencarboxamid hữu dụng để bảo vệ thực vật khỏi sự tấn công của các vi sinh vật gây hại thực vật. WO2004/062361 mô tả các hợp chất được cho là hữu ích để phòng trừ các bệnh do nấm. Chúng đạt được tác dụng của chúng thông qua ảnh hưởng trực tiếp lên các vi sinh vật không mong muốn nhưng cũng nhờ có tác dụng cảm ứng tính kháng trên thực vật. WO2004/062361 cũng đề xuất rằng các hợp chất này có thể hữu dụng trong việc phòng trừ các bệnh do vi khuẩn nhưng không đưa ra được bằng chứng bất kỳ về hoạt tính như vậy. Các hợp chất này được phát hiện bởi các tác giả sáng chế là có hiệu lực yếu chống lại *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* ở liều thấp.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) như được đề cập ở đây cũng như các chất đồng phân, các chất đa hình, 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 trong bản mô tả và ít nhất một chất mang thích hợp về mặt nông nghiệp.

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

Sáng chế đề cập đến phương pháp phòng trừ các vi sinh vật gây bệnh thực vật bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định trong bản mô tả hoặc chế phẩm như được xác định trong bản mô tả lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất trong đó thực vật sinh trưởng.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các định nghĩa

Thuật ngữ “alkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này trong ngữ cảnh của alkyl hoặc alkylsulfonyl, alkylsulfinyl, alkylthio, alkylamino, ví dụ, tốt hơn cần được hiểu có nghĩa là alkyl phân nhánh và không phân nhánh, có nghĩa là *ví dụ* methyl, ethyl, *n*-propyl, *iso*-propyl, *n*-butyl, *iso*-butyl, *tert*-butyl, *sec*-butyl, pentyl, *iso*-pentyl, hexyl, heptyl, octyl, nonyl và dextyl và các chất đồng phân của chúng.

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

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

Thuật ngữ “halogen” hoặc “Hal” như được sử dụng trong bản mô tả này được hiểu có nghĩa là flo, clo, brom hoặc iot.

Thuật ngữ “halo” hoặc “halogeno” (ví dụ, haloalkyl, “C₁-C₆-haloalkyl” hoặc “C₁-C₈-halogenoalkyl”) chỉ sự có mặt tùy ý của một hoặc nhiều phân tử thể halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “haloalkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này tốt hơn cần được hiểu có nghĩa là alkyl phân nhánh hoặc không phân nhánh, như được định nghĩa ở trên, trong đó một hoặc nhiều phần tử thế hydro được thay thế theo cách giống hoặc khác nhau bằng halogen. Đặc biệt tốt hơn, 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 “haloalkenyl” như được sử dụng ở đây tốt hơn cần được hiểu có nghĩa là alkenyl phân nhánh và không phân nhánh, như được xác định trên đây, trong đó một hoặc nhiều phần tử thế hydro được thay thế theo cách giống hoặc khác nhau bằng halogen.

Thuật ngữ “haloalkynyl” như được sử dụng ở đây tốt hơn cần được hiểu có nghĩa là alkynyl phân nhánh và không phân nhánh, như được xác định trên đây, trong đó một hoặc nhiều phần tử thế hydro được thay thế theo cách giống hoặc khác nhau bằng halogen.

Thuật ngữ “alkoxy” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm có công thức (alkyl)-O-, trong đó thuật ngữ “alkyl” là như được xác định trong bản mô tả. Ví dụ về C₁-C₈-alkoxy bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyletoxy, n-butoxy, 1-metylpropoxy, 2-metylpropoxy, 1,1-dimetyletoxy, n-pentoxo, 1-metylbutoxy, 2-metylbutoxy, 3-metylbutoxy, 2,2-dimetylpropoxy, 1-etylpropoxy, 1,1-dimetylpropoxy, 1,2-dimetylpropoxy, n-hexyloxy, 1-metylpentoxo, 2-metylpentoxo, 3-metylpentoxo, 4-metylpentoxo, 1,1-dimetylbutoxy, 1,2-dimetylbutoxy, 1,3-dimetylbutoxy, 2,2-dimetylbutoxy, 2,3-dimetylbutoxy, 3,3-dimetylbutoxy, 1-etylbutoxy, 2-etylbutoxy, 1,1,2-trimetylpropoxy, 1,2,2-trimetylpropoxy, 1-etyl-1-metylpropoxy và 1-etyl-2-metylpropoxy.

Thuật ngữ “halogenalkoxy” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm alkoxy như được xác định trên đây trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau. Ví dụ về C₁-C₈-halogenoalkoxy bao gồm nhưng không giới hạn ở clometoxy, bromometoxy, diclometoxy, triclometoxy, flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, cloflometoxy, dicloflometoxy, clodiflometoxy, 1-cloetoxo, 1-bromoetoxo, 1-floetoxo, 2-floetoxo,

2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-clo-2-floetoxy, 2-clo-2,2-difloetoxy, 2,2-diclo-2-floetoxy, 2,2,2-tricloetoxy, pentaflotoxy và 1,1,1-trifloprop-2-oxy.

Thuật ngữ “alkylsulfanyl” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có công thức (alkyl)-S-, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định trong bản mô tả. Ví dụ về C₁-C₈-alkylsulfanyl bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, nhóm metylsulfanyl, etylsulfanyl, propylsulfanyl, isopropylsulfanyl, butylsulfanyl, *sec*-butylsulfanyl, isobutylsulfanyl, *tert*-butylsulfanyl, pentylsulfanyl, isopentylsulfanyl, hexylsulfanyl.

Thuật ngữ “halogenoalkylsulfanyl” như được sử dụng ở đây chỉ alkylsulfanyl như được xác định trên đây trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “alkylsulfinyl” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có công thức (alkyl)-S(=O)-, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định trong bản mô tả. Ví dụ về C₁-C₈-alkylsulfinyl bao gồm nhưng không giới hạn ở các gốc alkylsulfinyl no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 8, tốt hơn là 1 đến 6 và tốt hơn nữa là 1 đến 4 nguyên tử cacbon, ví dụ (nhưng không giới hạn ở) metylsulfinyl, etylsulfinyl, propylsulfinyl, 1-metyletylsulfinyl, butylsulfinyl, 1-metylpropylsulfinyl, 2-metylpropylsulfinyl, 1,1-dimetyletylsulfinyl, pentylsulfinyl, 1-metylbutylsulfinyl, 2-metylbutylsulfinyl, 3-metylbutylsulfinyl, 2,2-dimetylpropylsulfinyl, 1-etylpropylsulfinyl, 1,1-dimetylpropylsulfinyl, 1,2-dimetylpropylsulfinyl, hexylsulfinyl, 1-metylpentylsulfinyl, 2-metylpentylsulfinyl, 3-metylpentylsulfinyl, 4-metylpentylsulfinyl, 1,1-dimetylbutylsulfinyl, 1,2-dimetylbutylsulfinyl, 1,3-dimetylbutylsulfinyl, 2,2-dimetylbutylsulfinyl, 2,3-dimetylbutylsulfinyl, 3,3-dimetylbutylsulfinyl, 1-etylbutylsulfinyl, 2-etylbutylsulfinyl, 1,1,2-trimetylpropylsulfinyl, 1,2,2-trimetylpropylsulfinyl, 1-etyl-1-metylpropylsulfinyl và 1-etyl-2-metylpropylsulfinyl..

Thuật ngữ “halogenoalkylsulfinyl” như được sử dụng ở đây chỉ alkylsulfinyl như được xác định trên đây trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “alkylsulfonyl” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có công thức $(\text{alkyl})-\text{S}(=\text{O})_2-$, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định trong bản mô tả. Ví dụ về C_1 - C_8 -alkylsulfonyl bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở, metylsulfonyl, etylsulfonyl, propylsulfonyl, 1-metyletylsulfonyl, butylsulfonyl, 1-metylpropylsulfonyl, 2-metylpropylsulfonyl, 1,1-dimetyletylsulfonyl, pentylsulfonyl, 1-metylbutylsulfonyl, 2-metylbutylsulfonyl, 3-metylbutylsulfonyl, 2,2-dimetylpropylsulfonyl, 1-etylpropylsulfonyl, 1,1-dimetylpropylsulfonyl, 1,2-dimetylpropylsulfonyl, hexylsulfonyl, 1-metylpentylsulfonyl, 2-metylpentylsulfonyl, 3-metylpentylsulfonyl, 4-metylpentylsulfonyl, 1,1-dimetylbutylsulfonyl, 1,2-dimetylbutylsulfonyl, 1,3-dimetylbutylsulfonyl, 2,2-dimetylbutylsulfonyl, 2,3-dimetylbutylsulfonyl, 3,3-dimetylbutylsulfonyl, 1-etylbutylsulfonyl, 2-etylbutylsulfonyl, 1,1,2-trimetylpropylsulfonyl, 1,2,2-trimetylpropylsulfonyl, 1-etyl-1-metylpropylsulfonyl và 1-etyl-2-metylpropylsulfonyl.

Thuật ngữ “halogenoalkylsulfonyl” như được sử dụng ở đây chỉ C_1 - C_8 -alkylsulfonyl như được xác định trên đây, trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “alkylcacbonyl” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có công thức $(\text{alkyl})-\text{C}(=\text{O})-$, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định trong bản mô tả.

Thuật ngữ “halogenoalkylcacbonyl” như được sử dụng ở đây chỉ alkylcacbonyl như được xác định trên đây, trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ “alkoxycacbonyl” như được sử dụng ở đây chỉ nhóm no, mạch thẳng hoặc mạch nhánh có công thức $(\text{alkoxy})-\text{C}(=\text{O})-$, trong đó thuật ngữ "alkoxy" là như được xác định trong bản mô tả.

Thuật ngữ “haloalkoxycacbonyl” như được sử dụng ở đây chỉ alkoxycacbonyl như được xác định trên đây, trong đó một hoặc nhiều nguyên tử hydro được thay thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen mà có thể giống hoặc khác nhau.

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

Thuật ngữ “heteroxyclyl” như được sử dụng trong bản mô tả chỉ các dị vòng no hoặc không no từng phần, bốn, năm hoặc sáu cạnh chứa một đến bốn nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ nhóm gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh. Nếu vòng này chứa nhiều hơn một nguyên tử oxy, chúng không liền kề trực tiếp với nhau.

Thuật ngữ “aryl” như được sử dụng trong bản mô tả này 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 một vòng hoặc đa vòng ngưng tụ (ví dụ, hai vòng hoặc ba vòng). Ví dụ về aryl bao gồm, nhưng không giới hạn ở, phenyl, azulenyl, naphtyl và florenyl. Cũng cần hiểu rằng khi nhóm aryl này được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế, thì (các) phần tử thế này có thể ở vị trí bất kỳ trên (các) vòng aryl này. Cụ thể, trong trường hợp aryl là nhóm phenyl, (các) phần tử thế này có thể chiếm 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 áp dụng cho aryl dưới dạng một phần của phần tử thế phức hợp (ví dụ, aryloxy).

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

Thuật ngữ “dị vòng thơm 5 đến 14 cạnh” hoặc “heteroaryl” như được sử dụng ở đây chỉ hệ vòng thơm chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ nhóm gồm oxy, nitơ và lưu huỳnh. Các dị vòng thơm bao gồm các dị vòng một vòng thơm 5- hoặc 6-cạnh và các dị vòng thơm đa vòng 6- đến 14-cạnh (ví dụ hai vòng

hoặc ba vòng). Dị vòng thơm 5- đến 14-cạnh có thể được kết nối với gốc của phân tử gốc thông qua nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử nitơ bất kỳ có trong dị vòng.

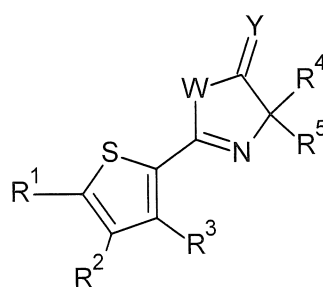
Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “C₁-C₆”, ví dụ trong ngữ cảnh của định nghĩa về “C₁-C₆-alkyl”, hoặc “C₁-C₆-alkoxy”, cần được hiểu nghĩa là nhóm có số nguyên tử cacbon hữu hạn từ 1 đến 6, tức là 1, 2, 3, 4, 5, hoặc 6 nguyên tử cacbon.

Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “C₁-C₈”, ví dụ trong ngữ cảnh của định nghĩa về “C₁-C₈-alkyl”, hoặc “C₁-C₈-alkoxy”, cần được hiểu nghĩa là nhóm có số nguyên tử cacbon hữu hạn từ 1 đến 8, tức là 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 hoặc 8 nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ "oxo" như được sử dụng ở đây chỉ nguyên tử oxy mà được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử lưu huỳnh qua liên kết đôi.

Thuật ngữ “nhóm rời chuyển” như được sử dụng trong bản mô tả này cần được hiểu nghĩa là nhóm được di chuyển từ một 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..

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



(I)

trong đó

R¹, R² độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl;

R³ được chọn từ nhóm gồm hydro, halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl;

W, Y độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm oxy, lưu huỳnh;

R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, aryl- C_1 - C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 , trong đó các gốc R^4 , R^5 không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^a và trong đó các gốc R^4 , R^5 không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b ; hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 hoặc dị vòng 3- đến 6-cạnh, trong đó vòng cacbon C_3 - C_6 và dị vòng 3- đến 6-cạnh có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b , R^a độc lập được chọn từ nhóm gồm nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluor- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_3 - C_7 -halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylamino, di- C_1 - C_8 -alkylamino, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfanyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, di- C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyloxy, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonylamino, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfinyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen; C_1 - C_8 -alkylsulfonylamino, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl ; C_1 - C_8 -alkylsulfamoyl và di- C_1 - C_8 -alkylsulfamoyl, R^b độc lập được chọn từ nhóm gồm nguyên tử halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluor- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_1 - C_8 -halogenoalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_3 - C_7 -halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_8 -alkylamino, di- C_1 - C_8 -alkylamino, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfanyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, di- C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến

5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcacbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcacbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcacbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcacbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, sulfamoyl, C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl;

với điều kiện nếu R¹ là halogen và R² là halogen, R³ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl hoặc C₁-C₆-haloalkyl.

với điều kiện nếu R¹ và R² là giống nhau và là brom hoặc clo, R³ là xyano hoặc C₁-C₆-haloalkyl hoặc W là lưu huỳnh hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào không tạo thành xyclopropyl.

Tốt hơn nếu R¹ được chọn từ nhóm gồm halogen, nhóm xyano.

Theo phương án ưu tiên khác R² là halogen.

Cũng tốt hơn nếu R³ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl.

Cũng tốt hơn nếu

R¹, R² độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl;

R³ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl;

W, Y độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm oxy, lưu huỳnh;

R⁴ và R⁵ độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, aryl-C₁-C₆-alkyl hoặc vòng cacbon C₃-C₆, trong đó các gốc R⁴, R⁵ không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều R^a phân tử thế và trong đó các gốc R⁴, R⁵ vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phân tử thế R^b; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆ hoặc dị vòng 3- đến 6-cạnh, trong đó vòng cacbon C₃-C₆ và dị vòng 3- đến 6-cạnh này có thể được thế bằng một hoặc

nhiều phần tử thể R^b , R^a độc lập được chọn từ nhóm gồm nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluor- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C₃-C₇-xycloalkyl, C₃-C₇-halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbamoyl, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl; C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl, R^b độc lập được chọn từ nhóm gồm nguyên tử halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluor- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₇-xycloalkyl, C₁-C₈-halogenoalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₃-C₇-halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbamoyl, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, sulfamoyl, C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl;

với điều kiện nếu R^1 là halogen và R^2 là halogen, R^3 được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl.

với điều kiện nếu R^1 và R^2 là giống nhau và là brom hoặc clo, R^3 là xyano hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc W là lưu huỳnh hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào không tạo thành xyclopropyl.

Cũng tốt hơn nếu R^3 được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl.

Các hợp chất có công thức (I) cũng được ưu tiên trong đó R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 .

Theo phương án ưu tiên khác W là oxy.

Cũng ưu tiên các hợp chất có công thức (I), trong đó Y là oxy.

Theo phương án được ưu tiên khác

R^1 được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano;

R^2 là halogen;

R^3 được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl;

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 ;

W là oxy;

Y là oxy.

Theo phương án được ưu tiên khác

R^1 được chọn từ nhóm gồm Cl, Br, xyano;

R^2 là Cl, Br;

R^3 được chọn từ nhóm gồm H, F, Cl, Br, I, CH_3 ;

R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 ;

W là oxy;

Y là oxy.

Theo một phương án khác, R^1 là halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^1 là halogen, xyano, C_1 - C_3 -alkyl hoặc C_1 - C_3 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^1 là halogen, xyano, metyl, triflometyl hoặc diflometyl. Theo một phương án khác, R^1 là halogen. Theo một phương án khác, R^1 là xyano, triflometyl hoặc diflometyl.

Theo một phương án khác, R^2 là halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^2 là halogen, xyano, C_1 - C_3 -alkyl hoặc C_1 - C_3 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^2 là halogen, xyano, metyl, triflometyl hoặc diflometyl. Theo một phương án khác, R^2 là halogen. Theo một phương án khác, R^2 là xyano, triflometyl hoặc diflometyl.

Theo một phương án khác, R^3 là hydro, halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^3 là hydro, halogen, xyano, C_1 - C_3 -alkyl hoặc C_1 - C_3 -haloalkyl. Theo một phương án khác, R^3 là hydro, halogen, xyano, metyl, triflometyl hoặc diflometyl. Theo một phương án khác, R^3 là halogen. Theo một phương án khác, R^3 là hydro. Theo một phương án khác, R^3 là xyano, metyl, triflometyl hoặc diflometyl.

Theo một phương án khác, R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, aryl- C_1 - C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 , trong đó các gốc R^4 , R^5 không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều R^a phần tử thế và trong đó các gốc R^4 , R^5 vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b . Theo một phương án khác, R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 hoặc dị vòng 3- đến 6-cạnh, trong đó vòng cacbon C_3 - C_6 và dị vòng 3- đến 6-cạnh này có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b . Theo một phương án khác, R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 , trong đó vòng cacbon C_3 - C_6 này có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b . Theo một phương án khác, R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành xyclopropyl hoặc xyclobutyl, trong đó xyclopropyl hoặc xyclobutyl này có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b .

Theo một phương án khác, W là oxy. Theo một phương án khác, W là lưu huỳnh. Theo một phương án khác, Y là oxy. Theo một phương án khác, Y là lưu huỳnh.

Cũng ưu tiên các hợp chất I.01 đến I.26 được mô tả trong phần thử nghiệm.

Bản mô tả không bao hàm các hợp chất thu được từ các tổ hợp trái với quy luật tự nhiên và người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực này do đó sẽ loại trừ chúng dựa trên hiểu biết chuyên môn của họ. Ví dụ, các cấu trúc vòng có 3 hoặc nhiều hơn 3 nguyên tử oxy liên kế được loại trừ.

Tùy thuộc vào bản chất của phân tử thể, hợp chất có công thức (I) có thể có mặt ở dạng các chất đồng phân lập thể khác nhau. Các chất đồng phân lập thể này là, ví dụ, chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atrop hoặc chất đồng phân hình học. Do đó, sáng chế bao gồm cả các chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ của các chất đồng phân này. Khi một hợp chất có thể có mặt ở hai hoặc nhiều dạng đồng phân hỗn biến ở trạng thái cân bằng, việc đề cập đến hợp chất này bằng cách mô tả một đồng phân hỗn biến cần được xem là bao gồm tất cả các dạng đồng phân hỗn biến.

Hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế còn có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng đồng phân hình học tùy thuộc vào số liên kết đôi trong hợp chất này. Các chất đồng phân hình học theo bản chất của các phân tử thể quanh liên kết đôi hoặc vòng có thể có mặt ở dạng *cis* (= *Z*-) hoặc *trans* (= *E*-). Do đó, sáng chế đề cập đồng đều 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 (ví dụ, hydrat) của nó.

Tùy thuộc vào bản chất của các phân tử thể, hợp chất có công thức (I) có thể có mặt ở dạng hợp chất tự do và/hoặc muối của nó, như muối có hoạt tính hóa nông.

Các muối có hoạt tính hóa nông bao gồm các muối cộng axit của axit vô cơ và hữu cơ cũng như muối của các bazơ thông thường. Ví dụ về các axit vô cơ là axit hydrohalogenic, như axit flohydric, axit clohydric, axit bromhydric và axit

hydroiodic, axit sulphuric, axit phosphoric và axit nitric, và các muối axit, như natri bisulfat và kali bisulfat. Các axit hữu cơ hữu dụng bao gồm, ví dụ, axit formic, axit cacbonic và các 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, các axit béo chưa bão hòa đơn hoặc chưa bão hòa đôi hoặc bão hòa có 6 đến 20 nguyên tử cacbon, các monoeste alkylsulfuric, các axit alkylsulfonic (axit sulfonic có gốc alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 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 có 1 đến 20 nguyên tử cacbon), axit arylphosphonic hoặc axit aryldiphosphonic (các gốc thơm, như phenyl và naphtyl, các gốc này chứa một hoặc hai gốc axit phosphonic), trong đó, các gốc alkyl và aryl có thể chứa các phần tử thể khác, ví dụ, axit p-toluensulfonic, axit salixylic, axit p-aminosalixylic, axit 2-phenoxybenzoic, axit 2-axetoxybenzoic, v.v..

Các solvat của các hợp chất có công thức (I) hoặc muối của chúng là hỗn hợp hóa học lượng pháp của các hợp chất này 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. Các dạng tinh thể bao gồm các dạng tinh thể không được solvat hóa, solvat và hydrat.

Sáng chế cũng đề cập đến hợp chất bất kỳ có công thức (I) được mô tả trong bảng 1 cũng như việc sử dụng chúng trong bảo vệ cây trồng (ví dụ để phòng trừ nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật).

Theo khía cạnh khác, 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.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm gây ra bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất có công thức

(I) theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất trong đó thực vật sinh trưởng.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế để phòng trừ các bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm gây ra trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật. Tốt hơn là chúng được sử dụng để phòng trừ các bệnh do nấm gây ra trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế để phòng trừ giun tròn trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm theo sáng chế để phòng trừ virus trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật.

Tốt hơn là hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế được sử dụng chống lại: Các bệnh do mầm bệnh nấm mốc bột gây ra, như loài *Podosphaera* (ví dụ *Podosphaera leucotricha*), loài *Sphaerotheca* (ví dụ *Sphaerotheca fuliginea*); các bệnh do mầm bệnh rỉ sét gây ra, như loài *Uromyces* (ví dụ *Uromyces appendiculatus*); các bệnh do mầm bệnh từ nhóm gồm Oomycetes, 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*); các bệnh đốm lá và các bệnh héo là do, ví dụ, loài *Alternaria* (ví dụ *Alternaria solani*), loài *Cercospora* (ví dụ *Cercospora beticola*), loài *Colletotrichum* (ví dụ *Colletotrichum lindemuthianum*), loài *Venturia* (ví dụ *Venturia inaequalis*) gây ra; các bệnh do mầm bệnh vi khuẩn, 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*) gây ra.

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

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

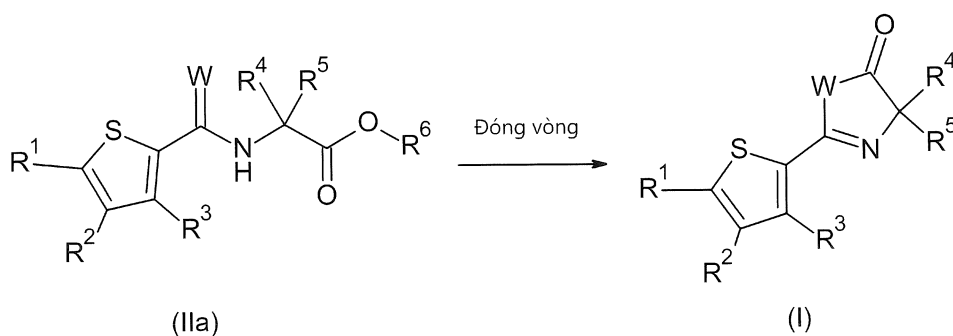
Sáng chế đề cập đến quy trình điều chế các hợp chất có công thức (I). Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng nhiều đường khác nhau tương tự như các quy trình đã biết được mô tả trong tài liệu Helvetica Chimica Acta, 69(2), 374-388, 1986; Helvetica Chimica Acta, 70(4), 1001-1011, 1987; Chimia, 36(2), 78-81, 1982; Helvetica Chimica Acta, 71(8), 2071-2084, 1988; Heterocyclic Communications, 9(2), 129-134; 2003; WO2007080885; WO2007003536, Chemical Communications (Cambridge, United Kingdom), 55(39), 5547-5550; 2019; và các tài liệu tham khảo khác trong đó, hoặc bằng một hoặc nhiều đường tổng hợp được mô tả sau đây và trong phần thử nghiệm.

Các cách tổng hợp chung các hợp chất có công thức (I)

Trừ khi được chỉ định khác, trong phần sau, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , W, Y có cùng ý nghĩa như được đưa ra trên đây đối với các hợp chất có công thức (I).

Quy trình A

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình A từ hợp chất có công thức (IIa) trong đó R^6 là hydro hoặc một trong số các muối của nó bằng phản ứng đóng vòng như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình A

Quy trình A có thể được thực hiện như được mô tả trong tài liệu Journal of Heterocyclic Chemistry, 25(1), 209-215; 1988; WO 2007003536.

Quy trình A có thể được thực hiện, nếu thích hợp, với sự có mặt của axit Brønsted, axit Lewis hoặc tác nhân ngưng tụ khác thích hợp, nếu thích hợp, với sự có mặt của chất liên kết axit thích hợp và nếu thích hợp với sự có mặt của dung môi.

Các axit Lewis thích hợp để thực hiện quy trình A có thể là axit Lewis vô cơ và hữu cơ thông thường cho các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các halogenua kim loại, như nhôm(III) clorua, sắt(III) clorua, kẽm(II) clorua, titan tetraclorea, bo triflorua; các triflat, như scandi(III) triflat, bismut(III) triflat hoặc ytterbi(III) triflat và cả iot.

Các axit Brønsted thích hợp để thực hiện quy trình A có thể là axit Brønsted vô cơ và hữu cơ thông thường cho các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng hydro halogenua, như hydro clorua hoặc hydro bromua; các axit sulfonic như axit *p*-toluensulfonic, axit camphorsulfonic, axit metansulfonic hoặc axit triflometansulfonic và cả axit polyphosphoric, axit phosphoric, axit sulfuric, kali bisulfit, axit trifloaxetic hoặc axit axetic.

Các tác nhân ngưng tụ thích hợp khác để thực hiện quy trình A có thể được chọn trong danh mục không giới hạn bao gồm chất tạo halogenua axit, như phosgen, phospho tribromua, phospho triclorea, phospho pentaclorua, phospho triclorea oxit, oxalyl clorua hoặc thionyl clorua; chất tạo anhydrit, như etyl cloroformat, metyl cloroformat, isopropyl cloroformat, isobutyl cloroformat hoặc metansulfonyl clorua; các anhydrit, như anhydrit trifloaxetic hoặc anhydrit axetic; carbodiimit, như N,N'-dixyclohexylcarbodiimit (DCC), N-(3-Dimetylaminopropyl)-N'-etylcarbodiimit hydroclorua (EDC) hoặc các tác nhân ngưng tụ thông thường khác, như phospho pentoxit, axit polyphosphoric, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic clorua, 1-[bis(dimetylaminometylen)-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridin-3-yl] 3-oxit hexafluorophosphat (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylamin tetrafluoroborat (TBTU), (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminoxy)dimetylaminomorpholino-carbenium

hexaflophosphat, N,N'-cacbonyl-diimidazol, 2-etoxy-N-etoxycarbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/tetraclo-metan, 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) và anhydrit propanphosphonic (T3P).

Các chất liên kết axit thích hợp để thực hiện quy trình A theo sáng chế trong từng trường hợp là tất cả các bazơ vô cơ và hữu cơ thường dùng 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.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình A không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ trơ thông thường miễn là nó không hòa tan hợp chất để phản ứng với nó hoặc thể hiện tương tác cụ thể bất kỳ với nó. Ưu tiên sử dụng các 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-dimetylaxetamit, N-metylformanilit, N-metylpyrrolidon hoặc hexametylphosphoric triamit; các ure, như 1,3-dimetyl-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pyrimidinon; các este, như metyl axetat hoặc etyl axetat, các sulfoxit, như dimetyl sulfoxit, hoặc các sulfon, như sulfolan; và hỗn hợp của các dung môi này.

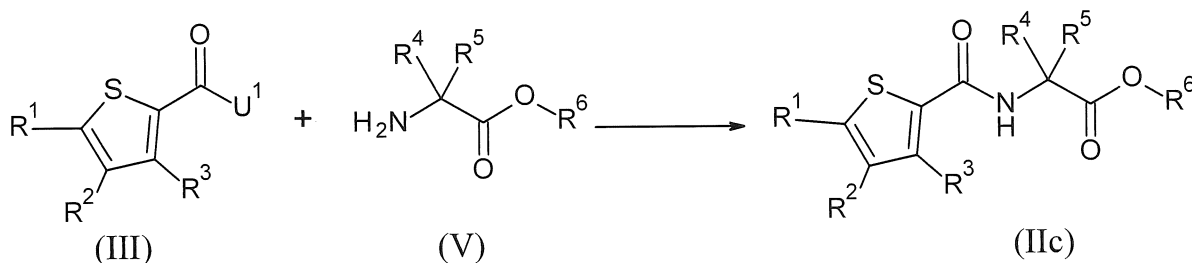
Quy trình A có thể được thực hiện trong khí quyển trơ. Khi thực hiện quy trình A, từ 0,01 đến 5% mol axit hoặc tác nhân ngưng tụ thích hợp có thể được sử dụng trên mỗi mol hợp chất có công thức (IIa) và từ 0,01 đến 5 mol chất liên kết axit trên

mỗi mol hợp chất có công thức (IIa). Cũng có thể sử dụng các thành phần phản ứng theo tỷ lệ khác. Việc làm sạch (work up) được thực hiện bằng các phương pháp đã biết.

Các hợp chất có công thức (IIa) trong đó R^6 là hydro có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IIb) trong đó R^6 là C_1 - C_6 -alkyl bằng các quy trình đã biết rõ như thủy phân. Ví dụ về các chất phản ứng thủy phân bao gồm lithi hydroxit, kali hydroxit, natri hydroxit, trimetyl tin hydroxit. Việc thủy phân có thể được thực hiện như được mô tả trong WO2008157844; WO2006002099; WO20050256107; Angewandte Chemie, International Edition (2005), 44(9), 1378-1382.

Quy trình B

Các hợp chất có công thức (IIc) trong đó R^6 là hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl có thể được điều chế bằng quy trình B bao gồm bước cho hợp chất có công thức (III) hoặc một trong số các muối của nó phản ứng với hợp chất có công thức (IV) hoặc một trong số các muối của nó như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau đây:



Quy trình B

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

Nếu U^1 là hydroxy, quy trình B được thực hiện một cách thuận lợi với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ. Các tác nhân ngưng tụ thích hợp có thể được trong danh mục không 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'-dixyclohexylcarbodiimit (DCC), N-(3-Dimetylaminopropyl)-N'-etylcarbodiimit hydroclorua (EDC) hoặc các tác nhân ngưng tụ thông thường

khác, như phospho pentoxit, axit polyphosphoric, bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic clorua, 1-[bis(dimetylamino)metylen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridini 3-oxit hexaflophosphat (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylamino tetraflorurat (TBTU), (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminoxy)dimetylamino-morpholino-carbenium hexaflophosphat, N,N'-cacbonyl-diimidazol, 2-etoxy-N-etoxycarbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/tetraclo-metan, 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) và anhydrit propanphosphonic (T3P) và 3-(dietoxyphosphoryloxy)-1,2,3-benzotriazin-4(3*H*)-on (DEPBT).

Nếu U^1 là halogen, quy trình B được thực hiện một cách thuận lợi với sự có mặt của chất liên kết axit. Các chất liên kết axit thích hợp để thực hiện quy trình B trong từng trường hợp là tất cả các bazơ vô cơ và hữu cơ thông thường cho các phản ứng như vậy. Ưu tiên các cacbonat kim loại kiềm, như xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, kali bicacbonat, natri bicacbonat, axetat kim loại kiềm thổ, như natri axetat, kali axetat, canxi axetat và amin bậc ba, như trimetylamino, trietylamino, diisopropyletylamino, tributylamino, N,N-dimetylanilin, N-metylpiperidin, N,N-dimetylpipridin-4-amino, diazabicyclooctan (DABCO), diazabicyclo-nonen (DBN) hoặc diazabicycloundecen (DBU), hoặc các bazơ thơm như pyridin.

Nếu U^1 là C_1 - C_6 -alkoxy, quy trình B có thể được thực hiện với lượng dư thành phần amino, tùy ý với sự có mặt của axit Lewis như nhôm trimetyl.

Nếu thích hợp, quy trình B 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 B không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ thông thường miễn là nó không hòa tan hợp chất để phản ứng với nó hoặc thể hiện tương tác cụ thể bất kỳ với nó. Ưu tiên sử dụng các 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, ISOPARTM E hoặc ISOPARTM G clobenzen, diclobenzen, diclometan,

cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc tricloetan; các ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl *tert*-butyl ete, metyl *tert*-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 2-metyltetrahydrofuran, 1,2-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-dimetylaxetamit, N-metylformanilit, N-metylpyrolidon hoặc hexametylphosphoric triamit; các ure, như 1,3-dimetyl-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pyrimidinon; các este, như metyl axetat hoặc etyl axetat, các sulfoxit, như dimetyl sulfoxit, hoặc các sulfon, như sulfolan; và hỗn hợp của các dung môi này.

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

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

Các hợp chất có công thức (IIIa) trong đó U^1 là hydroxy có bán trên thị trường, có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IIIb) trong đó U^1 là C_1 - C_6 -alkoxy bằng các quy trình đã biết rõ như thủy phân trong môi trường bazơ hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết (*Beilstein J. Org. Chem.* 2007, 3, No. 23)

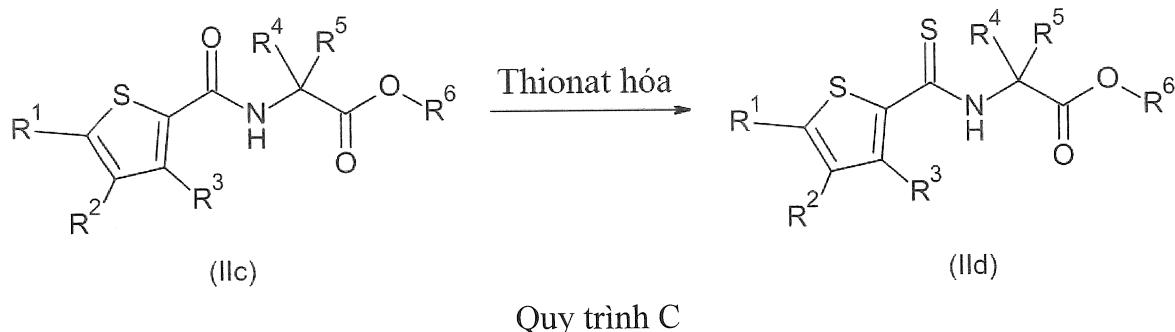
Các hợp chất có công thức (IIIc) trong đó U^1 là halogen có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IIIa) trong đó U^1 là hydroxy bằng các quy trình đã biết rõ.

Các hợp chất có công thức (IIIb) trong đó U^1 là C_1 - C_6 -alkoxy có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IIIa) trong đó U^1 là hydroxy bằng các quy trình đã biết rõ.

Quy trình C

Các hợp chất có công thức (IIId) trong đó R^6 là hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl có thể được điều chế bằng quy trình C từ hợp chất có công thức (IIc) trong đó R^6 là hydro

hoặc C₁-C₆-alkyl bằng cách thực hiện phản ứng thionat hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng sau:



Quy trình C theo sáng chế được thực hiện với sự có mặt của tác nhân thionat hóa.

Các tác nhân thionat hóa thích hợp để thực hiện quy trình C theo sáng chế có thể là lưu huỳnh (S), axit sulfhydric (H₂S), natri sulfua (Na₂S), natri hydrosulfua (NaHS), bo trisulfua (B₂S₃), bis(diethyl nhôm) sulfua ((AlEt₂)₂S), amoni sulfua ((NH₄)₂S), phosphor pentasulfua (P₂S₅), chất phản ứng Lawesson (2,4-bis(4-metoxypheyl)-1,2,3,4-dithiadiphosphetan 2,4-disulfua) hoặc chất phản ứng thionat hóa được hỗ trợ bởi polyme như được mô tả trong tài liệu Journal of the Chemical Society, Perkin 1 (2001), 358, tùy ý với sự có mặt của lượng xúc tác hoặc lượng tỷ lượng hoặc lượng dư, lượng bazơ như bazơ vô cơ và bazơ hữu cơ. Ưu tiên sử dụng các cacbonat kim loại kiềm, như natri cacbonat, potassium cacbonat, potassium bicarbonat, natri bicarbonat ; các bazơ dị vòng thơm, như pyridin, picolin, lutidin, colidin; và cả các amin bậc ba, như trimetylamin, trietylamin, tributylamin, N,N-dimetylanilin, N,N-dimetylpyridin-4-amin hoặc N-metyl-piperidin.

Các dung môi thích hợp để tiến hành quy trình C theo sáng chế là có thể là các dung môi hữu cơ trơ thông thường. Ưu tiên sử dụng các hydrocacbon béo, vòng béo, hoặc thơm tùy ý được halogen hóa, như ete dầu mỏ, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin, clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, dicloetan hoặc tricloetan, các ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl *t*-butyl ete, metyl *t*-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxietan hoặc 1,2-dietoxietan, các nitril, như axetonitril,

propionitril, *n*- hoặc *i*-butyronitril hoặc benzonitril, các dung môi chứa lưu huỳnh, như sulfolan hoặc cacbon disulfua.

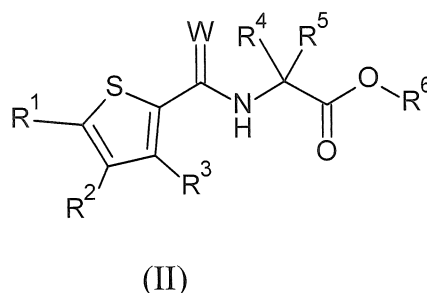
Khi thực hiện quy trình C theo sáng chế, 1 mol hoặc lượng dư lưu huỳnh tương đương của tác nhân thionat hóa và từ 1 đến 3 mol bazơ có thể được sử dụng trên một mol chất phản ứng amit (IIc).

Cũng có thể sử dụng các thành phần phản ứng theo tỷ lệ khác. Việc làm sạch (work up) được thực hiện bằng các phương pháp đã biết.

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

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

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



trong đó

R^1 , R^2 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl;

R^3 được chọn từ nhóm gồm hydro, halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl;

W độc lập được chọn từ nhóm gồm oxy, lưu huỳnh;

R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, aryl- C_1 - C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 , trong đó các gốc R^4 , R^5 không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^a và trong đó các gốc R^4 , R^5 vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b ; hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon

mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆ hoặc dị vòng 3- đến 6-cạnh, trong đó vòng cacbon C₃-C₆ và dị vòng 3- đến 6-cạnh này có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b, R^a độc lập được chọn từ nhóm gồm nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentaflor-λ⁶-sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C₃-C₇-xycloalkyl, C₃-C₇-halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbamoyl, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl ; C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl, R^b is độc lập được chọn từ nhóm gồm nguyên tử halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentaflor-λ⁶-sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₇-xycloalkyl, C₁-C₈-halogenoalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₃-C₇-halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbamoyl, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, C₁-C₈-alkoxycarbonyl, C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonylamino,

C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, sulfamoyl, C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl;

R⁶ được chọn từ nhóm gồm hydro, C₁-C₆-alkyl;

với điều kiện nếu R¹ là halogen và R² là halogen, R³ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl hoặc C₁-C₆-haloalkyl.

với điều kiện nếu R¹ và R² là giống nhau và là brom hoặc clo, R³ là xyano hoặc C₁-C₆-haloalkyl hoặc W là lưu huỳnh hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào không tạo thành xyclopropyl.

Chế phẩm và dạng phối chế

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm, cụ thể là chế phẩm để phòng trừ các vi sinh vật không mong muốn, chứa 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 chất lỏng, tự nhiên hoặc tổng hợp, hữu cơ hoặc vô cơ mà thường trơ. Chất mang thường cải thiện được việc áp dụng các hợp chất, chẳng hạn, lên thực vật, bộ phận của thực vật hoặc hạt. Ví dụ về các chất mang rắn thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các muối amoni, bột đá tự nhiên, như cao lanh, đất sét, talc, đá phấn, thạch anh, attapulgit, montmorillonit và đất diatomit, và bột đá tổng hợp như silic oxit nghiền mịn, nhôm oxit và các silicat. Ví dụ về các chất mang rắn hữu dụng điển hình để tạo hạt mịn bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, đá tự nhiên nghiền và phân mảnh như canxit, đá hoa cương, đá bột, sepiolit, dolomit và các hạt mịn tổng hợp từ bột vô cơ và hữu cơ và hạt mịn từ vật liệu hữu cơ như giấy, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô và cuống thuốc lá. Ví dụ về các chất mang thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, nước, các dung môi hữu cơ và tổ hợp của chúng. Ví dụ về các dung môi thích hợp bao gồm các chất lỏng hóa học hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ nhóm gồm các hydrocacbon thơm và không thơm (như xyclohexan, parafin, alkylbenzen, xylen, toluen alkylnaphtalen,

các hydrocacbon thơm được clo hóa hoặc các hydrocacbon béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua), các rượu và rượu đa chức (mà tùy ý cũng có thể được thế, ete hóa và/hoặc este hóa, như butanol hoặc glycol), các keton (như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon), các este (bao gồm các 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 các halohydrocacbon, 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, (các) chất tạo bọt, (các) chất phân tán, (các) chất làm ẩm ion hoặc không ion và hỗn hợp bất kỳ của chúng. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulfonic, muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphtalensulfonic, sản phẩm trùng ngưng của etylen và/hoặc propylen oxit với các rượu béo, các axit béo hoặc amin béo (các este của polyoxyetylen và axit béo, các ete polyoxyetylen rượu béo, ví dụ alkylaryl polyglycol ete), các phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulfosuccinic, các dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), các este phosphoric của rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, các este béo của polyol, và dẫn xuất của các hợp chất chứa sulfat, sulfonat, phosphat, (ví dụ alkylsulfonat, alkylsulfat, arylsulfonat) và sản phẩm thủy phân protein, dịch thải lignosulphit và metylxenuloza. 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 chế phẩm.

Các ví dụ khác về chất phụ trợ thông thường để phối chế các chế phẩm hóa nông bao gồm các chất đẩy nước, chất hút ẩm, chất liên kết (chất kết dính, chất dính, tác nhân cố định, như carboxymethylxenluloza, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt mịn hoặc latex, như gôm arabic, rượu polyvinyllic và polyvinyl axetat, các phospholipit tự nhiên như xephalin và lexithin và các phospholipit tổng hợp, polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza), các 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 tác nhân khác mà cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý), các thuốc nhuộm hoặc chất màu (như các chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và xanh Prussian; các thuốc nhuộm hữu cơ, ví dụ alizarin, azo và thuốc nhuộm phtaloxyanin kim loại), các chất chống tạo bọt (ví dụ, chất chống tạo bọt silicon và magie stearat), chất bảo quản (ví dụ, diclophen và hemiformal rượu benzylic), 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), các chất kết dính, gibberelin và các chất phụ trợ gia công, các dầu khoáng và dầu thực vật, nước hoa, sáp, các 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 được dự định để áp dụng hợp chất có công thức (I) và/hoặc liên quan đến các đặc tính vật lý. Hơn nữa, các chất phụ trợ có thể được chọn để truyền các đặc tính cụ thể (các đặc tính 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 có thể ở dạng chế phẩm thông thường bất kỳ, như dung dịch (ví dụ, dung dịch nước), nhũ tương, bột thấm ướt, huyền phù gốc nước và gốc dầu, bột, bụi, hồ, bột hòa tan, hạt mịn hòa tan, hạt mịn dễ rắc, thể đặc huyền phù nhũ tương, các sản phẩm tự nhiên hoặc tổng hợp được tẩm (các) hợp chất theo sáng chế, phân bón

và cả các vi nang trong chất nền polyme. Hợp chất có công thức (I) có thể có mặt ở dạng được tạo huyền phù, nhũ tương hoặc được hòa tan.

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

Chế phẩm có thể được điều chế theo 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 mô tả 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 hợp chất có công thức (I).

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

Các thành phần hoạt tính được đưa ra ở đây bằng tên chung của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu The Pesticide Manual (16th Ed. British Crop Protection Council) hoặc có thể tìm kiếm trên mạng internet (ví dụ www.alanwood.net/pesticides).

Khi hợp chất (A) hoặc hợp chất (B) có thể có mặt ở dạng hỗn hợp, hợp chất như vậy được hiểu trong phần trên và dưới đây là còn bao gồm, khi có thể áp dụng được, các dạng hỗn hợp tương ứng, ngay cả khi các dạng này không được đề cập cụ thể trong từng trường hợp.

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

1) Các chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.001) cyproconazole, (1.002) difenoconazole, (1.003) epoxiconazole, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamine, (1.008) fluquinconazole, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfat, (1.012) ipconazole, (1.013) metconazole, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazole, (1.018) prothioconazole, (1.019) pyrisoxazole, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazole, (1.022) tetraconazole, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazole, (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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-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-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-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) mefentrifluconazole, (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-(chlorometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xcyclopentanol, (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) ipfentrifluconazole, (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-cacbonitril, (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) metyl 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-2-hydroxy-3-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propanoat.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp tại phức I hoặc phức II , ví dụ (2.001) benzovindiflupyr, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr, (2.009) Isofetamid, (2.010) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh kháng epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh kháng epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (raxemat kháng epime 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp raxemat dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS và raxemat kháng epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh syn-epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh syn-epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (raxemat dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen, (2.020) Pyraziflumid, (2.021) sedaxane, (2.022) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.023) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.024) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.025) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.026) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamid, (2.027) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.028) inpyrfluxam, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) fluindapyr, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-

clo-2-ethylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) isoflucypram, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.051) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.057) pyrapropoyn, (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, (2.060) flubeneteram.

3) Các chất ức chế tchuỗi hô hấp tại phức III, ví dụ (3.001) ametotradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadone, (3.010) fenamidone, (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)ethyliden]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) fenpicoxamid, (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) metyltetraprole, (3.031) florylpicoxamid.

4) Các chất ức chế nguyên phân và phân bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolide, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazole, (4.007) thiophanat-metyl, (4.008) zoxamide, (4.009) pyridachlometyl, (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) fluopimomide.

5) Các hợp chất có khả năng hoạt động ở nhiều vị trí, ví dụ (5.001) hỗn hợp bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) chlorothalonil, (5.005) copper hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxyclorea, (5.009) đồng(2+) sulfat, (5.010) dithianon, (5.011) dodine, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram zinc, (5.017) oxine-copper, (5.018) propineb, (5.019) lưu huỳnh và các chế phẩm lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etyl-5,7-dioxa-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) probenazole, (6.004) tiadinil.

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

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

9) Các chất ức chế sinh tổng hợp thành tế bào, ví dụ (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethomorph, (9.003) flumorph, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pyrimorph, (9.007) valifenalate, (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) tolclorfen-metyl.

11) Các chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.001) tricyclazole, (11.002) tolprocarb.

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) iprodione, (13.003) procymidone, (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) mepyridinocap.

15) Các chất diệt nấm khác được chọn từ nhóm gồm (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazole, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamide, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-calcium, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) methyl isothioxyanat, (15.016) metrafenone, (15.017) mildiomicin, (15.018) natamycin, (15.019) nicken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapiprolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentachlorophenol và các muối, (15.025) axit phosphor và các muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetilate, (15.027) pyriofenone (chlazafenone), (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanide, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) dipymetitrone, (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-metoxypheyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazoline, (15.039) 2-
 {(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-
 thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.040) 2-
 {(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-
 thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.041)
 ipflufenquin, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-
 2-ol, (15.043) 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)quinolie, (15.047) quinofumelin, (15.048) 4-
 amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng đồng phân hồ biến: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-
 on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic, (15.050) 5-amino-1,3,4-
 thiadiazol-2-thiol, (15.051) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen-2-
 sulfonohydrazit, (15.052) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.053) 5-
 flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.054) 9-flo-2,2-dimetyl-5-
 (quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepin, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-
 metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamát,
 (15.056) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, axit (15.057) 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}carbamát, (15.062) 5-flo-4-
 imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on,
 (15.063) aminopyrifin, (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)quinolon, (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]benzamid), (15.074) metyl {4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl}carbamit, (15.075) (N-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}xyclopropancarboxamid), (15.076) N-metyl-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.077) N-[(E)-metoxyiminometyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.078) N-[(Z)-metoxyiminometyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.079) N-[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]xyclopropancarboxamid, (15.080) N-(2-flophenyl)-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.081) 2,2-diflo-N-metyl-2-[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]axetamid, (15.082) N-allyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]axetamid, (15.083) N-[(E)-N-metoxi-C-metyl-cacbonimidoyl]-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.084) N-[(Z)-N-metoxi-C-metyl-cacbonimidoyl]-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzamid, (15.085) N-allyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]propanamid, (15.086) 4,4-dimetyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]pyrolidin-2-on, (15.087) N-metyl-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzencarbothioamid, (15.088) 5-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]pyrolidin-2-on, (15.089) N-((2,3-diflo-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl)-3,3,3-triflo-propanamid, (15.090) 1-metoxi-1-metyl-3-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.091) 1,1-dietyl-3-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.092) N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]propanamid, (15.093) N-metoxi-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]xyclopropancarboxamid, (15.094) 1-metoxi-3-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.095) N-metoxi-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]xyclopropancarboxamid, (15.096) N,2-dimetoxi-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]propanamid, (15.097) N-etyl-2-metyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-

yl]phenyl]methyl]propanamit, (15.098) 1-metoxi-3-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]ure, (15.099) 1,3-dimetoxi-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]ure, (15.100) 3-etyl-1-metoxi-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]ure, (15.101) 1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]piperidin-2-on, (15.102) 4,4-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]isoxazolidin-3-on, (15.103) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]isoxazolidin-3-on, (15.104) 3,3-dimetyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]piperidin-2-on, (15.105) 1-[[3-flo-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]azepan-2-on, (15.106) 4,4-dimetyl-2-[[4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]isoxazolidin-3-on, (15.107) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]methyl]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-metylxcyclopropyl)-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-metylpyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.115) 1-(5-(fluorometyl)-6-metylpyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.116) 1-(6-(diflometyl)-5-metoxi-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}propanamid, (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]acetyl}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]acetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-9-flo-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl metansulfonat, (15.123) 1-(6,7-dimethylpyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.124) 8-flo-N-(4,4,4-triflo-2-metyl-1-phenylbutan-2-yl)quinoline-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.

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.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến một hoặc nhiều tổ hợp hợp chất sau:

(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) + (2.001), (I.01) + (2.002), (I.01) + (2.003), (I.01) + (2.004), (I.01) + (2.005), (I.01) +

(2.006), (I.01) + (2.007), (I.01) + (2.008), (I.01) + (2.009), (I.01) + (2.010), (I.01) +
 (2.011), (I.01) + (2.012), (I.01) + (2.013), (I.01) + (2.014), (I.01) + (2.015), (I.01) +
 (2.016), (I.01) + (2.017), (I.01) + (2.018), (I.01) + (2.019), (I.01) + (2.020), (I.01) +
 (2.021), (I.01) + (2.022), (I.01) + (2.023), (I.01) + (2.024), (I.01) + (2.025), (I.01) +
 (2.026), (I.01) + (2.027), (I.01) + (2.028), (I.01) + (2.029), (I.01) + (2.030), (I.01) +
 (2.031), (I.01) + (2.032), (I.01) + (2.033), (I.01) + (2.034), (I.01) + (2.035), (I.01) +
 (2.036), (I.01) + (2.037), (I.01) + (2.038), (I.01) + (2.039), (I.01) + (2.040), (I.01) +
 (2.041), (I.01) + (2.042), (I.01) + (2.043), (I.01) + (2.044), (I.01) + (2.045), (I.01) +
 (2.046), (I.01) + (2.047), (I.01) + (2.048), (I.01) + (2.049), (I.01) + (2.050), (I.01) +
 (2.051), (I.01) + (2.052), (I.01) + (2.053), (I.01) + (2.054), (I.01) + (2.055), (I.01) +
 (2.056), (I.01) + (2.057), (I.01) + (2.058), (I.01) + (2.059), (I.01) + (2.060), (I.01) +
 (3.001), (I.01) + (3.002), (I.01) + (3.003), (I.01) + (3.004), (I.01) + (3.005), (I.01) +
 (3.006), (I.01) + (3.007), (I.01) + (3.008), (I.01) + (3.009), (I.01) + (3.010), (I.01) +
 (3.011), (I.01) + (3.012), (I.01) + (3.013), (I.01) + (3.014), (I.01) + (3.015), (I.01) +
 (3.016), (I.01) + (3.017), (I.01) + (3.018), (I.01) + (3.019), (I.01) + (3.020), (I.01) +
 (3.021), (I.01) + (3.022), (I.01) + (3.023), (I.01) + (3.024), (I.01) + (3.025), (I.01) +
 (3.026), (I.01) + (3.027), (I.01) + (3.028), (I.01) + (3.029), (I.01) + (3.030), (I.01) +
 (3.031), (I.01) + (4.001), (I.01) + (4.002), (I.01) + (4.003), (I.01) + (4.004), (I.01) +
 (4.005), (I.01) + (4.006), (I.01) + (4.007), (I.01) + (4.008), (I.01) + (4.009), (I.01) +
 (4.010), (I.01) + (4.011), (I.01) + (4.012), (I.01) + (4.013), (I.01) + (4.014), (I.01) +
 (4.015), (I.01) + (4.016), (I.01) + (4.017), (I.01) + (4.018), (I.01) + (4.019), (I.01) +
 (4.020), (I.01) + (4.021), (I.01) + (4.022), (I.01) + (4.023), (I.01) + (4.024), (I.01) +
 (4.025), (I.01) + (4.026), (I.01) + (5.001), (I.01) + (5.002), (I.01) + (5.003), (I.01) +
 (5.004), (I.01) + (5.005), (I.01) + (5.006), (I.01) + (5.007), (I.01) + (5.008), (I.01) +
 (5.009), (I.01) + (5.010), (I.01) + (5.011), (I.01) + (5.012), (I.01) + (5.013), (I.01) +
 (5.014), (I.01) + (5.015), (I.01) + (5.016), (I.01) + (5.017), (I.01) + (5.018), (I.01) +
 (5.019), (I.01) + (5.020), (I.01) + (5.021), (I.01) + (5.022), (I.01) + (5.023), (I.01) +
 (6.001), (I.01) + (6.002), (I.01) + (6.003), (I.01) + (6.004), (I.01) + (7.001), (I.01) +
 (7.002), (I.01) + (7.003), (I.01) + (7.004), (I.01) + (7.005), (I.01) + (7.006), (I.01) +
 (8.001), (I.01) + (9.001), (I.01) + (9.002), (I.01) + (9.003), (I.01) + (9.004), (I.01) +
 (9.005), (I.01) + (9.006), (I.01) + (9.007), (I.01) + (9.008), (I.01) + (9.009), (I.01) +

(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 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. Chẳng hạn, tổ hợp (I.01) + (1.001) tương ứng với tổ hợp bao gồm hợp chất I.01 trong bảng 1 và cyproconazole (1.001).

Theo một số phương án khác, các tổ hợp hợp chất tương ứng với các tổ hợp được mô tả trên đây trong đó hợp chất (I.01) được thay thế bằng hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất được nêu trong bảng 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 tác nhân kiểm soát sinh học.

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

(A) Các tác nhân kháng vi khuẩn được chọn từ nhóm gồm:

(A1) Các vi khuẩn, như (A1.1) *Bacillus subtilis*, cụ thể là chủng QST713/AQ713 (có bán với tên gọi SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO của hãng Bayer CropScience LP, US, có số truy cập NRRL là B21661 và được mô tả

trong bằng Mỹ số 6,060,051); (A1.2) *Bacillus amyloliquefaciens*, cụ thể là chủng D747 (có bán với tên gọi Double Nickel™ của hãng Certis, US, có số truy cập FERM là BP-8234 và được mô tả trong bằng Mỹ số 7,094,592); (A1.3) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng BU F-33 (có số truy cập NRRL là 50185); (A1.4) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* chủng FZB24 (có bán với tên gọi Taegro® của hãng Novozymes, US); (A1.5) chủng *Paenibacillus* sp. có số truy cập NRRL là B-50972 hoặc có số truy cập NRRL là B-67129 và được mô tả trong công bố đơn 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 bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM14941;

(B) Các tác nhân diệt nấm được chọn từ nhóm gồm:

(B1) Vi khuẩn, ví dụ (B1.1) *Bacillus subtilis*, cụ thể là chủng QST713/AQ713 (có bán với tên gọi SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO của hãng Bayer CropScience LP, US, có số truy cập NRRL là B21661 và được mô tả trong bằng Mỹ số 6,060,051); (B1.2) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng QST2808 (có bán với tên gọi SONATA® của hãng Bayer CropScience LP, US, có số truy cập NRRL là B-30087 và được mô tả trong bằng Mỹ số 6,245,551); (B1.3) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng GB34 (có bán với tên gọi Yield Shield® của hãng Bayer AG, DE); (B1.4) *Bacillus pumilus*, cụ thể là chủng BU F-33 (có số truy cập NRRL là 50185); (B1.5) *Bacillus amyloliquefaciens*, cụ thể là chủng D747 (có bán với tên gọi Double Nickel™ của hãng Certis, US, có số truy cập FERM BP-8234 và được mô tả trong bằng Mỹ số 7,094,592); (B1.6) *Bacillus subtilis* Y1336 (có bán với tên gọi BIOBAC® WP của hãng Bion-Tech, Taiwan, được đăng ký làm tác nhân diệt nấm sinh học ở Đài Loan với số đăng ký 4764, 5454, 5096 và 5277); (B1.7) *Bacillus amyloliquefaciens* chủng MBI 600 (có bán với tên gọi SUBTILEX của hãng BASF SE); (B1.8) *Bacillus subtilis* chủng GB03 (có bán với tên gọi Kodiak® của hãng Bayer AG, DE); (B1.9) *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* chủng FZB24 (của hãng Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia hoặc Syngenta Crop Protection,

LLC, Greensboro, North Carolina làm tác nhân diệt nấm TAEGRO® hoặc TAEGRO® ECO (số đăng ký EPA 70127-5); (B1.10) *Bacillus mycoides*, thể phân lập J (có bán với tên gọi BmJ TGAI hoặc WG của hãng Certis USA); (B1.11) *Bacillus licheniformis*, cụ thể là chủng SB3086 (có bán với tên gọi EcoGuard TM Biofungicide và Green Releaf của hãng Novozymes); (B1.12) chủng *Paenibacillus* sp. có số truy cập NRRL là B-50972 hoặc có số truy cập NRRL là B-67129 và được mô tả trong công bố đơn 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 fengycin 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. Các chủng *Bacillus* có khả năng tạo ra các lipopeptit bao gồm *Bacillus subtilis* QST713 (có bán với tên gọi SERENADE OPTI hoặc SERENADE ASO của hãng Bayer CropScience LP, US, có số truy cập NRRL là B21661 và được mô tả trong bằng Mỹ số 6,060,051), *Bacillus amyloliquefaciens* chủng D747 (có bán với tên gọi Double Nickel™ của hãng Certis, US, có số truy cập FERM BP-8234 và được mô tả trong bằng Mỹ số 7,094,592); *Bacillus subtilis* MBI600 (có bán với tên gọi SUBTILEX® của hãng Becker Underwood, US số đăng ký EPA 71840-8); *Bacillus subtilis* Y1336 (có bán với tên gọi BIOBAC® WP của hãng Bion-Tech, Taiwan, được đăng ký làm tác nhân diệt nấm sinh học ở Đài Loan với các số đăng ký 4764, 5454, 5096 và 5277); *Bacillus amyloliquefaciens*, cụ thể là chủng FZB42 (có bán với tên gọi RHIZOVITAL® của hãng ABiTEP, DE); và *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (của hãng Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia hoặc Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina làm tác nhân diệt nấm TAEGRO® hoặc TAEGRO® ECO (số đăng ký EPA 70127-5); và

(B2) nấm, ví dụ: (B2.1) *Coniothyrium minitans*, cụ thể là chủng CON/M/91-8 (có số truy cập là DSM-9660; ví dụ Contans ® của hãng Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, cụ thể là chủng NRRL Y-30752 (ví dụ Shemer®); (B2.3)

Microsphaeropsis ochracea (ví dụ Microx® của hãng Prophyta); (B2.5) *Trichoderma spp.*, bao gồm *Trichoderma atroviride*, chủng SC1 được mô tả trong đơn sáng chế quốc tế số PCT/IT2008/000196); (B2.6) *Trichoderma harzianum rifai* chủng KRL-AG2 (còn gọi là chủng T-22, /ATCC 208479, ví dụ PLANTSHIELD T-22G, Rootshield®, và TurfShield của hãng BioWorks, US); (B2.14) *Gliocladium roseum*, chủng 321U của hãng W.F. Stoneman Company LLC; (B2.35) *Talaromyces flavus*, chủng V117b; (B2.36) *Trichoderma asperellum*, chủng ICC 012 của hãng Isagro; (B2.37) *Trichoderma asperellum*, chủng SKT-1 (ví dụ ECO-HOPE® của hãng Kumiai Chemical Industry); (B2.38) *Trichoderma atroviride*, chủng CNCM I-1237 (ví dụ Esquive® WP của hãng Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, chủng V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, chủng LC52 (ví dụ Tenet của hãng 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® của hãng Makhteshim, US); (B2.49) *Trichoderma harzianum*, cụ thể là chủng KD (ví dụ Trichoplus của hãng Biological Control Products, SA (mua lại bởi Becker Underwood)); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, chủng ITEM 908 (ví dụ Trianum-P của hãng Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, chủng TH35 (ví dụ Root-Pro của hãng Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (còn gọi là *Gliocladium virens*), cụ thể là chủng GL-21 (ví dụ SoilGard 12G của hãng Certis, US); (B2.53) *Trichoderma viride*, chủng TV1 (ví dụ Trianum-P của hãng Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, cụ thể là chủng AQ 10 (ví dụ AQ 10® của hãng 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 bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM 14941 (ví dụ Botector® của hãng bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, chủng H39 (của hãng Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (tên gọi khác:

Clonostachys rosea f. catenulate) chủng J1446 (ví dụ, Prestop® của hãng AgBio Inc. và ví dụ, Primastop® của hãng Kemira Agro Oy); (B2.70) *Lecanicillium lecanii* (trước đây gọi là *Verticillium lecanii*) conidia Chủng KV01 (ví dụ Vertalec® của hãng 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* (formerly *T. viride*), chủng ICC080 (IMI CC 392151 CABI, ví dụ BioDerma của hãng AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, chủng DB 103 (e.g., T-Gro 7456 của hãng Dagutat Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, chủng IMI 206039 (ví dụ Binab TF WP của hãng BINAB Bio-Innovation AB, Sweden); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (ví dụ Tricovab của hãng Ceplac, Brazil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, cụ thể là chủng HRU3 (ví dụ Botry-Zen® của hãng Botry-Zen Ltd, NZ); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (formerly *V. dahliae*), chủng WCS850 (CBS 276.92; ví dụ Dutch Trig của hãng Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) hỗn hợp *Trichoderma asperellum* chủng ICC 012 và *Trichoderma gamsii* chủng ICC 080 (sản phẩm được biết là ví dụ BIO-TAM™ của hãng Bayer CropScience LP, US).

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 các chế phẩm chứa chúng là:

vi khuẩn được chọn từ nhóm gồm *Bacillus cereus*, cụ thể là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 và *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (số truy cập CNCM I-1582), *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (số truy cập NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, cụ thể là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), chủng AM65-52 (số truy cập 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 (số truy cập ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), và *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (số truy cập NRRL 30232);

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

vi khuẩn và nấm mà có thể được bổ sung làm 'thành phần cấy' lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc các cơ quan của thực vật và nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ là: *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, 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 cấp mà có thể được sử dụng làm tác nhân phòng trừ sinh học, như *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (chất chiết saponin của *Chenopodium quinoa*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, Regalia, "RequiemTM Insecticide", rotenone, *ryania/ryanodine*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, chất chiết *Brassicaceae*, cụ thể là bột cải dầu hoặc bột mù tạc.

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

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ như, các cacbamat, chẳng hạn alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các phosphat hữu cơ, ví dụ acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-methyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoate, phorate, phosalone, 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 chlordan và endosulfan hoặc phenylpyrazol (các fiprole), ví dụ ethiprole và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ các pyrethroid, chẳng hạn acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin s-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], deltamethrin, empenthrin [chất đồng phân (EZ)-(1R)], esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate,

flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momfluorothrin, 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.

Các chất điều biến cạnh tranh với thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic axetylcholine receptor - nAChR) ví dụ, các neonicotinoid, chẳng hạn acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam hoặc nicotine hoặc sulfoxaflor hoặc flupyradifurone.

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

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

(7) Các chất bắt chước hormon sâu non, ví dụ như, chất tương tự hormon sâu non, ví dụ, hydropren, kinopren và methopren hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các chất ức chế không đặc hiệu (nhiều vị trí) hỗn hợp, ví dụ như các alkyl halogenua, chẳng hạn, metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc chloropicrine hoặc sulfuryl fluorua hoặc borax hoặc tartar emetic hoặc các tác nhân tạo metyl 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 etoxazole.

(11) Các tác nhân vi khuẩn phá vỡ màng ruột côn trùng, ví dụ như *Bacillus thuringiensis* phân loài *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *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 ATP synthaza ty thể, như các chất phá vỡ ATP, ví dụ như diafenthiuron hoặc các hợp chất hữu cơ thiếc, ví dụ azoxyclostin, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargite 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, thiocylam, và thiosultap-natri.

(15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 0, ví dụ như bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxycloxuron, 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 (cụ thể là đối với Diptera, tức là, côn trùng hai cánh), ví dụ như cyromazine.

(18) Các chất chủ vận thụ thể Ecdysone, ví dụ như chromafenozide, halofenozide, metoxyfenozide và tebufenozide.

(19) Các chất chủ vận thụ thể Octopamine ví dụ như amitraz.

(20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể, ví dụ như hydramethylnone hoặc acequinocyl 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, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenone (Derris).

(22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế, ví dụ như indoxacarb hoặc metaflumizone.

(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, chẳng hạn nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua hoặc các xyanua, chẳng hạn 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, chẳng hạn cyenopyrafen và cyflumetofen và các carboxanilit chẳng hạn như pyflubumide.

(28) Các chất điều biến thụ thể ryanodine, ví dụ như các diamit, chẳng hạn chlorantraniliprole, cyantraniliprole và flubendiamide,

các hoạt chất khác, ví dụ như Afidopyropen, Afoxolaner, Azadirachtin, Benclothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Broflanilide, Bromopropylate, Chinomethionat, Chloroprallethrin, Cryolite, Cyclaniliprole, Cycloxaprid, Cyhalodiamide, Dicloromezotiaz, Dicofol, epsilon-Metofluthrin, epsilon-Momfluthrin, Flometoquin, Fluazaindolizine, Fluensulfone, Flufenerim, Flufenoxystrobin, Flufiprole, Fluhexafon, Fluopyram, Fluralaner, Fluxametamide, Fufenozide, Guadipyr, Heptafluthrin, Imidaclothiz, Iprodione, kappa-Bifenthrin, kappa-Tefluthrin, Lotilaner, Meperfluthrin, Paichongding, Pyridalyl, Pyrifluquinazon, Pyriminostrobin, Spirobudiclofen, Tetramethylfluthrin, Tetraniliprole, Tetrachlorantraniliprole, Tigolaner, Tioxazafen, Thiofluoximate, Triflumezopyrim và iodometan; hơn nữa là các chế phẩm trên cơ sở *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và cả các hợp chất sau đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã biết qua 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 qua 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 qua 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 qua 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 qua EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl-piperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết qua

WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết qua JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), *N*-[(2*E*)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1*H*)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (đã biết qua WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3*E*)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflo-propan-2-on (đã biết qua WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), , *N*-[3-(benzylcarbamoyl)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafluoetyl)-4-(triflometyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (đã biết qua WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-*N*-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã biết qua CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*cis*-1-oxito-3-thietanyl)-benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*trans*-1-oxito-3-thietanyl)-benzamit và 4-[(5*S*)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-*N*-(*cis*-1-oxito-3-thietanyl)benzamit (đã biết qua WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), *N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit, (+)-*N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit và (-)-*N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit (đã biết qua WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[2*E*)-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-cacbonitril (đã biết qua 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 qua CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); *N*-[4-clo-2-[[1,1-dimetyletyl]amino]cacbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (đã biết qua 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 qua 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 qua CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2*E*)- và 2(*Z*)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-*N*-[4-(diflometoxy)phenyl]-hydrazincarboxamit (đã

biết qua CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); este của axit 3-(2,2-dicloetenyl)-2, 2-dimetyl-4-(1*H*-benzimidazol-2-yl)phenyl-xyclopropanecarboxylic (đã biết qua CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4*aS*)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[[(metoxycacbonyl)[4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]cacbonyl]-indeno[1,2-*e*][1,3,4]oxadiazin-4*a*(3*H*)-carboxylic (đã biết qua 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-pentafluoroetoxy)phenyl]-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]- α -L-mannopyranoza (đã biết qua 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 qua 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 qua WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và *N*-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(metylamino)cacbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (đã biết qua CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)-4-[[4-(triflometyl)phenyl]metoxy]-pyrimidin (đã biết qua 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 qua 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 qua WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etyl este của 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-cacbonic (đã biết qua WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), *N*-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1*H*)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit (đã biết qua DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [*N*(*E*)]-*N*-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1*H*)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit (đã biết qua WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [*N*(*Z*)]-*N*-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1*H*)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit, (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-

propoxy-4-(triflometyl)phenoxy]-9-[[5-(triflometyl)-2-pyridinyl]oxy]-9-azabixclo[3.3.1]nonan (đã biết qua WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

Ví dụ về các chất an toàn mà có thể được trộn với các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng là, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenchlorazole (-etyl), fenclorim, flurazole, fluxofenim, furilazole, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphthalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoil)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).

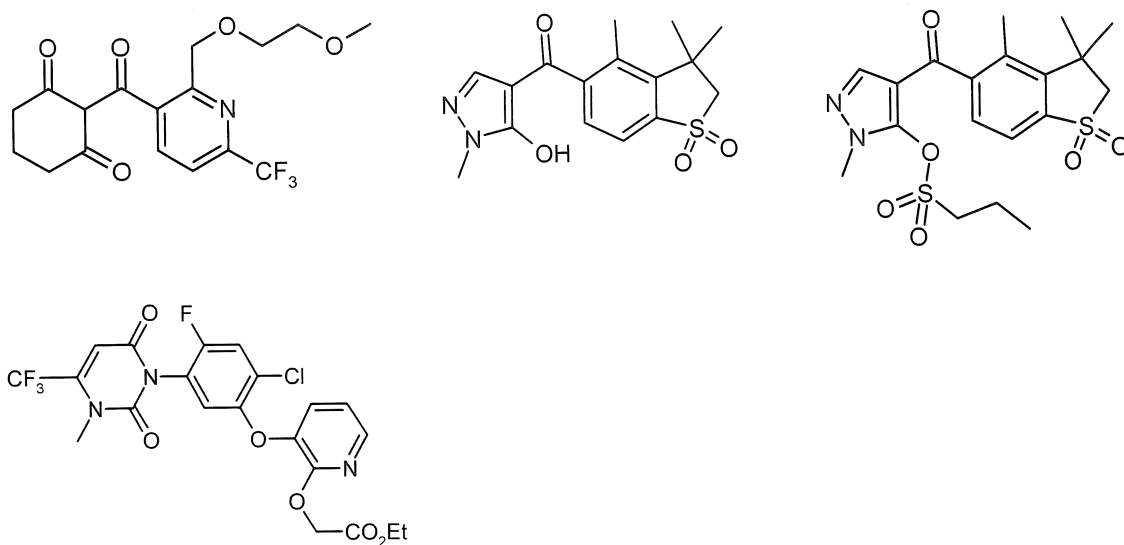
Ví dụ về các tác nhân diệt cỏ mà có thể được trộn với các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng là:

Acetochlor, 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, amitrole, amonisulfamat, anilofos, asulam, atrazine, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-etyl, benfluralin, benfuresate, bensulfuron, bensulfuron-metyl, bensulide, bentazone, benzobixyclon, benzofenap, bixyclopyron, bifenox, bilanafos, bilanafos-natri, bispyribac, bispyribac-natri, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil-butytrat, -kali, -heptanoat, và -octanoat, busoxinone, butachlor, butafenacil, butamifos, butenachlor, butralin, butroxydim, butylat, cafenstrole, carbetamide, carfentrazone, carfentrazone-etyl, chloramben, chlorbromuron, chlorfenac, chlorfenac-natri, chlorfenprop, chlorflurenol, chlorflurenol-metyl, chloridazon, chlorimuron, chlorimuron-etyl, chlorophthalim, chlorotoluron, chlorthal-dimetyl, chloresulfuron, cinidon, cinidon-etyl, cinmetylin, cinosulfuron, clacyfos, clethodim, clodinafop, clodinafop-propargyl, clomazone, clomeprop, clopyralid, cloransulam, cloransulam-metyl, cumyluron, cyanamide, cyanazine, xycloate, xyclopyrimorate, xyclosulfamuron,

xycloxydim, cyhalofop, cyhalofop-butyl, cyprazine, 2,4-D, 2,4-D-butotyl, -butyl, -dimetylammonium, -diolamin, -etyl, -2-ethylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylammonium, -kali, -triisopropanolamoni, và -trolamine, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimetylammonium, -isooctyl, -kali, và -natri, daimuron (dymron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosyl-pyrazolat (DTP), dicamba, diclobenil, 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, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramine, dinoterb, diphenamid, diquat, diquat-dibromid, dithiopyr, diuron, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, ethalfluralin, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethiozin, ethofumesate, etoxyfen, etoxyfen-etyl, etoxysulfuron, etobenzanid, F-9600, F-5231, tức là N-{2-clo-4-flo-5-[4-(3-flopropyl)-5-oxo-4,5-dihydro-1H-tetrazol-1-yl]phenyl}etansulfonamit, F-7967, tức là 3-[7-clo-5-flo-2-(triflometyl)-1H-benzimidazol-4-yl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4(1H,3H)-dion, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, fenoxaprop-P-etyl, fenoxasulfone, fenquinotrine, fentrazamide, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flzasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl, flucarbazone, flucarbazone-natri, flucetosulfuron, fluchloralin, flufenacet, flufenpyr, flufenpyr-etyl, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butyl, -dimetylammonium và -metyl, fluoroglycofen, fluoroglycofen-etyl, flupropanate, flupyr-sulfuron, flupyr-sulfuron-metyl-natri, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl, flurtamone, fluthiacet, fluthiacet-metyl, fomesafen, fomesafen-natri, foramsulfuron, fosamine, glufosinate, glufosinate-amoni, glufosinate-P-natri, glufosinate-P-amoni, glufosinate-P-natri, glyphosate, glyphosate-amoni, -isopropylammonium, -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, hexazinone, HW-02, tức là 1-(dimetoxyposphoryl) 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, ipfencarbazone, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutole, karbutilate, KUH-043, tức là 3-([5-(diflometyl)-1-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-yl]metyl)sulfonyl)-5,5-dimetyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotyl, -dimethylamoni, -2-etylhexyl, -isopropylamoni, -kali, và -natri, MCPB, MCPB-metyl, -etyl và -natri, mecoprop, mecoprop-natri, và -butotyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, -dimethylamoni, -2-etylhexyl, và -kali, mefenacet, mefluidide, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrione, methabenzthiazuron, metam, metamifop, met amitron, 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, napropamide, 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 dichloride, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorophenol, pentoxazone, pethoxamid, các dầu mỏ, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-metyl, prodiamine, profoxydim, prometon, prometryn, propachlor, propanil, propaquizafop, propazine, propham, propisochlor, propoxycarbazone, propoxycarbazone-natri, propyrisulfuron, propyzamide, prosulfocarb, prosulfuron, pyraclonil, pyraflufen, pyraflufen-etyl, pyrasulfotole, pyrazolynate (pyrazolate), pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazoxyfen, pyribambenz, pyribambenz-isopropyl, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, pyridate, pyriftalid, pyriminobac, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyriothiobac, pyriothiobac-natri, pyroxasulfone, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinclamine, quizalofop, quizalofop-etyl,

quizalofop-P, quizalofop-P-etyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, setoxydim, siduron, simazine, simetryn, SL-261, sulcotrion, sulfentrazone, 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, tefuryltrione, tembotrione, tepraloxym, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbuthylazin, terbutryn, thenylchlor, thiazopyr, thiencarbazone, thiencarbazone-metyl, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, thiobencarb, tiafenacil, tolpyralate, topramezone, tralkoxydim, triafamone, tri-allate, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tribenuron-metyl, triclopyr, trietazine, trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-natri, trifludimoxazin, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, tritosulfuron, ure sulfat, vernolate, XDE-848, ZJ-0862, tức là 3,4-diclo-N-{2-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)oxy]benzyl}anilin, và các hợp chất sau:



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

Acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, axit 5-aminolevulinic, ancymidol, 6-benzylaminopurine, Brassinolid, catechine, chlormequat clorua, cloprop, cyclanilide, axit 3-(xycloprop-1-enyl) propionic, daminozide, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-natri, endothal, endothal-dikali, -disnatri, và -mono(N,N-dimetylalkylamoni), ethephon, flumetralin, flurenol, flurenol-butyl, flurprimidol,

forchlorfenuron, gibberellic acid, inabenfide, axit indol-3-axetic (IAA), axit 4-indol-3-ylbutyric, isoprothiolane, probenazole, axit jasmonic, maleic hydrazit, mepiquat clorua, 1-metylxyclopropan, metyl jasmonate, 2-(1-naphtyl)axetamit, axit 1-naphtylaxetic, axit 2-naphtyloxyaxetic, nitrophenolat-hỗn hợp, paclobutrazol, N-(2-phenyletyl)-beta-alanin, axit N-phenylphthalamic, prohexadione, prohexadione-canxi, prohydrojasmon, axit salicylic, strigolactone, tecnazene, thidiazuron, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etyl, tsitodef, uniconazole, uniconazole-P.

Các phương pháp và sử dụng

Các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng có hoạt tính diệt vi sinh vật mạnh mẽ. Các hợp chất và chế phẩm này có thể được sử dụng để phòng trừ các vi sinh vật không mong muốn, như nấm và vi khuẩn không mong muốn. Chúng có thể đặc biệt hữu dụng trong bảo vệ cây trồng (chúng phòng trừ các vi sinh vật gây 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 chế phẩm chứa chúng có thể được sử dụng để bảo vệ hạt, hạt nảy mầm, cây giống đã nhú, thực vật, các bộ phận của thực vật, quả, sản phẩm thu hoạch và/hoặc đất trong đó thực vật sinh trưởng khỏi các vi sinh vật không mong muốn.

Thuật ngữ phòng trừ hoặc việc phòng trừ như được sử dụng ở đây bao gồm việc xử lý bảo vệ, chữa trị và diệt trừ các vi sinh vật không mong muốn. Các vi sinh vật không mong muốn có thể là các vi khuẩn gây bệnh, virus gây bệnh, nấm mốc (oomycetes) gây bệnh hoặc nấm gây bệnh, cụ thể hơn là vi khuẩn gây bệnh ở thực vật, virus gây bệnh ở thực vật, nấm mốc gây bệnh ở thực vật hoặc nấm gây bệnh ở thực vật. Như được mô tả chi tiết sau đây, các vi sinh vật gây bệnh ở thực vật này là nguyên nhân của phổ rộng bệnh 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” chỉ hợp chất hoặc chế phẩm mà có thể được sử dụng trong bảo vệ cây trồng để phòng trừ nấm không mong muốn, như Plasmodiophoromycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes và Deuteromycetes

và/hoặc để phòng trừ nấm noãn, tốt hơn là để phòng trừ Basidiomycetes (gây bệnh rỉ sét).

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ các vi sinh vật không mong muốn, như nấm, nấm noãn và vi khuẩn gây bệnh ở thực vật, bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc ít nhất một chế phẩm chứa chúng lên các vi sinh vật này và/hoặc môi trường sống của chúng (lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất trong đó thực vật sinh trưởng).

Thông thường, khi hợp chất và chế phẩm theo sáng chế được sử dụng trong các phương pháp chữa trị hoặc bảo vệ để phòng trừ nấm gây bệnh thực vật và/hoặc nấm noãn gây bệnh thực vật, lượng hữu hiệu và tương thích với thực vật của chúng được đưa lên thực vật, các bộ phận của thực vật, quả, hạt hoặc lên đất hoặc nền trong đó thực vật sinh trưởng. Các nền thích hợp mà có thể được sử dụng trong canh tác thực vật bao gồm các nền gốc vô cơ, như bông khoáng, đặc biệt là bông đá, peclit, cát hoặc sỏi; các nền hữu cơ, như than bùn, vỏ thông hoặc mùn cưa; và các nền gốc dầu mỡ như xốp polyme hoặc hạt chất dẻo. Lượng hữu hiệu và tương thích với thực vật nghĩa là lượng đủ để phòng trừ hoặc tiêu diệt nấm có mặt hoặc có khả năng xuất hiện trên đất trồng và mà không gây ra triệu chứng độc thực vật đáng kể nào đối với cho cây trồng. Lượng như vậy có thể thay đổi trong phạm vi rộng phụ thuộc vào nấm cần được phòng trừ, loại cây trồng, giai đoạn sinh trưởng của cây trồng, các điều kiện khí hậu và hợp chất hoặc chế phẩm tương ứng 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 lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật bất kỳ.

Thực vật ở đây có nghĩa là tất cả thực vật và quần thể thực vật như thực vật hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (gồm cả các 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 kỹ thuật di truyền hoặc tổ hợp của các phương pháp này, bao gồm cả thực vật biến đổi gen (GMO hoặc thực vật chuyển gen) và các giống cây trồng có khả năng được bảo vệ hoặc không được bảo vệ bằng 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 nằm trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, hoa và rễ, ví dụ về các bộ phận 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 sau thu hoạch và vật liệu nhân 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 các phương pháp theo sáng chế bao gồm các thực vật sau: bông, lanh, nho, cây ăn quả, rau, như *Rosaceae sp.* (ví dụ cây họ táo như táo và lê, và cả các quả hạch như mơ, anh đào, quả hạnh và đào, và các 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, cây chuối và các khu vườn thơm), *Rubiaceae sp.* (ví dụ, cà phê), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (ví dụ, chanh, cam và bưởi); *Solanaceae sp.* (ví dụ, cà chua), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (ví dụ, rau diếp), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (ví dụ, dưa chuột), *Alliaceae sp.* (ví dụ, tỏi tây, hành), *Papilionaceae sp.* (ví dụ, đậu Hà Lan); các cây trồng chính, như *Gramineae sp.* (ví dụ ngô, vạt cỏ, ngũ cốc như lúa mì, lúa mạch đen, lúa gạo, đại mạch, yến mạch, kê và tiểu hắc mạch), *Asteraceae sp.* (ví dụ, hướng dương), *Brassicaceae sp.* (ví dụ, bắp cải trắng, bắp cải đỏ, bông 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 dùng cho chăn nuôi, cải cầu vòng, 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 thực vật trong số này.

Theo một số phương án được ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và giống thực vật, hoặc những thực vật thu nhận bằng các phương pháp nhân giống sinh học thông

thường, như lai chéo hoặc dung hợp tế bào trần, và các bộ phận của chúng, được xử lý bằng các phương pháp theo sáng chế.

Theo một số phương án được ưu tiên khác, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng các phương pháp kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (các 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 nếu các cây từ giống thực vật có bán trên thị trường hoặc đang sử dụng được xử lý theo sáng chế. Các giống thực vật cần được hiểu nghĩa là thực vật có các đặc tính ("tính trạng") mới và đã thu được bằng các kỹ thuật nhân giống thông thường, bằng các kỹ thuật gây đột biến hoặc bằng kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Chúng có thể là giống cây trồng, giống thực vật, các kiểu sinh học hoặc kiểu gen

Các 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 gen khác loại đã được tích hợp ổn định vào trong hệ gen của nó. Cách biểu thị "gen khác loại" về cơ bản nghĩa là gen mà được cung cấp hoặc được thu thập bên ngoài thực vật và khi được đưa vào trong nhân, hệ gen lục lạp hoặc hệ gen ty thể mang đến cho thực vật chuyển dạng các đặc tính nông học mới hoặc đặc tính nông học được cải thiện hoặc các đặc tính khác bằng cách biểu hiện protein hoặc polypeptit mong muốn hoặc bằng cách điều chỉnh theo hướng làm giảm hoặc làm bất hoạt (các) gen khác mà có mặt ở thực vật (ví dụ, sử dụng công nghệ đối nghĩa, công nghệ đồng ức chế, công nghệ can thiệp ARN (RNAi) hoặc công nghệ microARN (miRNA)). Gen khác loại nằm trong hệ gen còn được gọi là gen chuyển. Gen chuyển được xác định bởi vị trí cụ thể của nó trong hệ gen thực vật được gọi là sự kiện biến nạp 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 truyền các tính trạng hữu dụng, đặc biệt có lợi cho các thực vật này (bất kể thu được bằng phương pháp nhân giống và/hoặc phương pháp công nghệ sinh học hay không).

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng các 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, các 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, vi khuẩn, virus và/hoặc viroït gây bệnh thực vật.

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng các phương pháp đã mô tả trên đây là các thực vật kháng 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 tăng, tiếp xúc ozon, tiếp xúc ánh sáng cao, tình trạng hạn chế về các chất dinh dưỡng nitơ, tình trạng hạn chế 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 bao gồm các thực vật đặc trưng bởi các đặc tính về năng suất được tăng cường. Năng suất được nâng cao ở các thực vật này có thể là kết quả của, ví dụ, sinh lý thực vật, khả năng sinh trưởng và phát triển được cải thiện, như hiệu suất sử dụng nước, hiệu suất giữ nước, sử dụng nitơ được cải thiện, khả năng đồng hóa cacbon được tăng cường, quang hợp được cải thiện, hiệu quả nảy mầm tăng và chín nhanh. Năng suất còn 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 chỉ giới hạn ở, ra hoa sớm, kiểm soát ra hoa để sản xuất hạt lai, sức sống của cây con, kích cỡ thực vật, số lượng và khoảng cách giống, sinh trưởng rễ, kích thước hạt, kích thước quả, kích thước vỏ, số lượng vỏ hoặc bông, số lượng hạt trên mỗi vỏ hoặc bông, khối lượng hạt, tăng hạt 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 tốt hơn.

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

Các 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 các thực vật và giống thực vật mà chịu được chất diệt cỏ, tức là, các thực vật chịu được một hoặc nhiều chất diệt cỏ nhất định. Các 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.

Các 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 các thực vật và giống thực vật chuyển gen kháng côn trùng, tức là, các thực vật được tạo tính kháng lại sự tấn công của các côn trùng đích nhất định. Các 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.

Các 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. Các 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 điều kiện bất lợi như vậy.

Các 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 các 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 các đặc tính của các thành phần đặc trưng của sản phẩm thu hoạch thay đổi.

Các 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 các thực vật và giống thực vật như cây bông, với các đặc tính sợi thay đổi. Các 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.

Các 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 các thực vật và giống thực vật như cải hạt dầu hoặc các cây thuộc chi cải (*Brassica*) liên quan với các đặc tính protein dầu thay đổi. Các 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 protein dầu thay đổi như vậy.

Các 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 các thực vật và giống thực vật như cải hạt dầu hoặc các cây thuộc chi cải liên quan, với các đặc tính vờ hạt thay đổi. Các 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 vờ hạt thay đổi như vậy và bao gồm các thực vật như cải hạt dầu với đặc tính vờ hạt chậm hoặc giảm.

Các 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 các 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:

các bệnh do mầm bệnh nấm mốc bột, 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*) gây ra;

các bệnh do mầm bệnh rỉ sét, như loài *Gymnosporangium* (ví dụ *Gymnosporangium sabinae*), loài *Hemileia* (ví dụ *Hemileia vastatrix*), loài *Phakopsora* (ví dụ *Phakopsora pachyrhizi* hoặc *Phakopsora meibomia*), 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 Oomycetes, 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*, syn: *Helminthosporium*) hoặc *Cochliobolus miyabeanus*), loài *Colletotrichum* (ví dụ *Colletotrichum lindemuthianum*), loài *xycloconium* (ví dụ *xycloconium 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*) gây ra,

các bệnh ở rễ và thân do, ví dụ, loài *Corticium* (ví dụ *Corticium graminearum*), 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 chùm (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 fruit 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*, *Bipolaris* Syn: *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 graminea*), loài *Pyricularia* (ví dụ *Pyricularia oryzae*), loài *Pythium* (ví dụ *Pythium ultimum*), loài *Rhizoctonia* (ví dụ *Rhizoctonia solani*), loài *Rhizopus* loài (ví dụ *Rhizopus oryzae*), loài *Sclerotium* (ví dụ *Sclerotium rolfii*), loài *Septoria* (ví

dụ *Septoria nodorum*), loài *Typhula* (ví dụ *Typhula incarnate*), loài *Verticillium* (ví dụ *Verticillium dahlia*) gây ra;

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

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

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

các 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;

các 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 mồi nước, hạt trước khi nhú mầm và hạt với rễ và lá đã nhú mầm.

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 còn bảo vệ cả thực vật nảy mầm, cây non đã nhú mầm và thực vật sau khi nhú mầm.

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

Khi thực hiện xử lý hạt trước khi gieo (ví dụ, còn gọi là ứng dụng trên hạt), việc xử lý hạt có thể được thực hiện như sau: hạt có thể được đưa vào máy trộn với lượng mong muốn của (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng (nguyên như vậy hoặc sau khi pha loãng), hạt và (các) hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng được trộn đến khi phân phối được 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 này. Phần lớn thương tổn đối với cây trồng do các sinh vật có hại gây ra đều bắt nguồn từ sự gây nhiễm 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 là 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, thực vật nảy mầm và cây non đã nhú lên, tổng quát hơn là phương pháp bảo vệ cây trồng khỏi các vi sinh vật gây bệnh thực vật, phương pháp này bao gồm bước sử dụng hạt đã 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 để không xảy ra bất kỳ tổn hại nào trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ 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 cứng, cuống, vỏ hạt, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt đã được thu hoạch, làm sạch và làm khô đến hàm lượng ẩm nhỏ hơn 15% khối 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 trong 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 được 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 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 này là các chế phẩm dùng ngay hoặc có thể là các thể đặc mà cần được pha loãng trước khi sử dụng.

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, các chất độn thông thường và dung môi hoặc chất pha loãng, thuốc nhuộm, chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberelin và cả nước.

Các chế phẩm này được điều chế theo cách đã biết, bằng cách trộn các thành phần hoạt tính hoặc tổ hợp thành phần hoạt tính với 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 hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberelin và cả nước.

Các thuốc nhuộm hữu dụng mà có thể có mặt trong chế phẩm 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 các thuốc nhuộm tan trong nước. Ví dụ bao gồm các thuốc nhuộm đã biết với tên gọi Rhodamin B, C.I. thuốc nhuộm Đỏ 112 và C.I. Đỏ dung môi 1. Các chất làm ướt hữu dụng mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt là tất cả các chất mà thúc đẩy việc làm ướt và thường được sử dụng cho các chế phẩm 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 dụng mà có thể có mặt trong các chế phẩm xử lý hạt là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng cho chế phẩm chứa các thành phần hoạt tính hóa nông. Ưu tiên sử dụng chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp các chất phân tán không ion hoặc anion. Các chất phân tán không ion hữu dụng hợp bao gồm đặc biệt là các polyme khối etylen oxit/propylen oxit, các alkylphenol polyglycol ete và tristyrylphenol polyglycol ete và các dẫn xuất được phosphat hoá hoặc sulphat hoá của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là các lignosulfonat, các muối của axit polyacrylic và các sản phẩm ngưng tụ arylsulfonat/formaldehyt. Các chất chống tạo bọt mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt là tất cả các chất ức chế bọt thường dùng cho chế phẩm chứa các 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 mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt là tất cả các chất có thể sử dụng cho mục đích như vậy trong các chế phẩm hoá nông. Các ví dụ bao gồm diclophen và hemiformal rượu benzylic. Các chất làm đặc thứ cấp mà có thể có mặt trong chế phẩm 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 ưu tiên bao gồm các dẫn xuất xenluloza, dẫn xuất của axit acrylic, xanthan, đất sét biến tính và silic oxit nghiền mịn. Các chất kết dính có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong các sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic 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 mỳ, đại mạch, hắc mạch, kê, tiểu hắc mạch, và yến mạch), cải hạt dầu, ngô, bông, đậu tương, lúa gạo, khoai tây, hướng dương, đậu, cà phê, đậu Hà Lan, 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, cải hạt dầu, ngô và lúa gạo.

Các hợp chất có công thức (I) hoặc các 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.

Giun tròn

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "giun tròn" bao gồm tất cả các loài thuộc ngành Nematoda và ở đây cụ thể là các loài hoạt động ở dạng ký sinh trùng trên thực vật hoặc nấm (ví dụ, các loài thuộc bộ Aphelenchida, Meloidogyne, Tylenchida và các bộ khác) hoặc theo cách khác trên người và động vật (ví dụ, các loài thuộc bộ Trichinellida, Tylenchida, Rhabditina và Spirurida) và gây ra thương tổn tại hoặc trên các sinh vật sống này và cả giun sán ký sinh khác.

Tác nhân diệt giun tròn trong bảo vệ cây trồng, như được mô tả ở đây, có khả năng phòng trừ giun tròn.

Thuật ngữ "phòng trừ giun tròn" có nghĩa là tiêu diệt giun tròn hoặc ngăn ngừa hoặc cản trở sự phát triển hoặc sự sinh trưởng của chúng hoặc ngăn ngừa hoặc cản trở sự xâm nhập của chúng vào trong hoặc sự hấp thụ của chúng vào trong mô thực vật.

Ở đây, hiệu quả của các hợp chất được xác định bằng cách so sánh tỷ lệ chết, sự hình thành nốt sần, sự hình thành nang kén, mật độ giun tròn trên mỗi thể tích đất, mật độ giun tròn trên mỗi rễ, số lượng trứng giun tròn trên thể tích đất, khả năng di động của giun tròn giữa thực vật hoặc bộ phận của thực vật được xử lý bằng hợp

chất có công thức (I) hoặc đất được xử lý và thực vật hoặc bộ phận của thực vật chưa được xử lý hoặc đất chưa được xử lý (100%). Tốt hơn nếu tỷ lệ giảm đạt được là từ 25% đến 50% so với thực vật, bộ phận của thực vật chưa được xử lý hoặc đất chưa được xử lý, đặc biệt tốt hơn là từ 51% đến 79% và đặc biệt tốt hơn nữa là tiêu diệt hoàn toàn hoặc ngăn chặn hoàn toàn sự phát triển và sinh trưởng của giun tròn với tỷ lệ giảm từ 80% đến 100%. Việc phòng trừ giun tròn như được mô tả ở đây cũng bao gồm việc kiểm soát sự tăng sinh của giun tròn (sự phát triển của nang kén 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 các hợp chất này có thể được sử dụng để chữa bệnh, phòng ngừa hoặc theo đường hệ thống để phòng trừ giun tròn.

Người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực kỹ thuật này đã biết rõ các phương pháp để xác định tỷ lệ chết, sự hình thành nốt sần, sự hình thành nang kén, mật độ giun tròn trên một thể tích đất, mật độ giun tròn trên một rễ, số lượng trứng giun tròn trên một thể tích đất, khả năng di chuyển của giun tròn.

Việc sử dụng hợp chất có công thức (I) có thể giữ cho thực vật khỏe mạnh và cũng bao gồm việc làm giảm thiểu tổn hại do giun tròn gây ra và làm tăng sản lượng thu hoạch.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "giun tròn" dùng để chỉ giun tròn ở thực vật bao gồm tất cả các giun tròn mà gây tổn hại cho thực vật. Giun tròn ở thực vật bao gồm giun tròn ký sinh trên thực vật và giun tròn sống trong đất. Giun tròn ký sinh trên thực vật bao gồm ngoại ký sinh trùng như *Xiphinema* spp., *Longidorus* spp. và *Trichodorus* spp.; bán ký sinh trùng như *Tylenchulus* spp.; sinh vật nội ký sinh trùng di chuyển như *Pratylenchus* spp., *Radopholus* spp. và *Scutellonema* spp.; ký sinh trùng không di chuyển như *Heterodera* spp., *Globodera* spp. và *Meloidogyne* spp., và cả nội ký sinh trùng trên cuống và lá như *Ditylenchus* spp., *Aphelenchoides* spp. và *Hirschmaniella* spp. Đặc biệt là giun tròn sống trong đất ký sinh gây hại rễ, ví dụ, giun tròn tạo nang kén thuộc chi *Heterodera* hoặc *Globodera*, và/hoặc giun tròn tạo nốt sần rễ thuộc chi *Meloidogyne*. Các loài gây hại thuộc các chi này là, ví dụ, *Meloidogyne incognita*, *Heterodera glycines* (giun tròn tạo nang kén ở đậu tương), *Globodera pallida* và *Globodera rostochiensis* (giun tròn tạo nang kén ở cà chua

vàng), các loài này được phòng trừ một cách hiệu quả bằng các hợp chất được mô tả trong tài liệu này. Tuy nhiên, việc sử dụng các hợp chất được mô tả trong tài liệu này không nghĩa là chỉ giới hạn ở các chi hoặc loài này, mà còn mở rộng theo cùng cách đến các giun tròn khác.

Các giun tròn ở thực vật bao gồm, ví dụ, *Aglenchus agricola*, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragaria*, và các nội ký sinh trùng 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 nội ký sinh trùng ở thân và lá *Ditylenchus* spp., *Dolichodorus heterocephalus*, *Globodera pallida* (= *Heterodera pallida*), *Globodera rostochiensis* (giun tròn tạo nang kén ở khoai tây vàng), *Globodera solanacearum*, *Globodera tabacum*, *Globodera virginia* và các ký sinh trùng tạo nang không di cư *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 tạo nang kén ở đậu tương), *Heterodera oryzae*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera zeae* và các ký sinh trùng tạo nang kén không di cư *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 ngoại ký sinh trùng *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 ký sinh trùng không di cư *Meloidogyne* spp., *Meloinema* spp.,
Nacobbus aberrans, *Neotylenchus vigissi*, *Paraphelenchus pseudoparietinus*,
Paratrichodorus allius, *Paratrichodorus lobatus*, *Paratrichodorus minor*,
Paratrichodorus nanus, *Paratrichodorus porosus*, *Paratrichodorus teres* và
Paratrichodorus spp., *Paratylenchus hamatus*, *Paratylenchus minutus*, *Paratylenchus*
projectus và *Paratylenchus* spp., *Pratylenchus agilis*, *Pratylenchus allenii*,
Pratylenchus andinus, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus*
coffaeae, *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 zeae* và các nội ký sinh trùng di cư *Pratylenchus* spp.,
Pseudohalenchus minutus, *Psilenchus magnidens*, *Psilenchus tumidus*, *Punctodera*
chalcoensis, *Quinisulcius acutus*, *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, các
ngoại ký sinh trùng di cư *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 nội ký sinh trùng di cư *Scutellonema* spp., *Subanguina*
radiciola, *Tetylenchus nicotianae*, *Trichodorus cylindricus*, *Trichodorus minor*,
Trichodorus primitivus, *Trichodorus proximus*, *Trichodorus similis*, *Trichodorus*
sparsus và các ngoại ký sinh trùng *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 nửa ký sinh trùng *Tylenchulus* spp., *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema dimorphicaudatum*, *Xiphinema index* và các ngoại ký sinh trùng *Xiphinema* spp.

Giun tròn mà hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để kiểm soát chúng bao gồm giun tròn thuộc giống *Meloidogyne* như giun tròn tạo sần rễ phương nam (*Meloidogyne incognita*), giun tròn tạo sần rễ Javanese (*Meloidogyne javanica*), giun tròn tạo sần rễ phương bắc (*Meloidogyne hapla*) và giun tròn tạo sần rễ đậu phộng (*Meloidogyne arenaria*); giun tròn thuộc giống *Ditylenchus* như giun tròn gây thối cà chua (*Ditylenchus destructor*) và giun lươn ở cuống và hành (*Ditylenchus dipsaci*); giun tròn thuộc giống *Pratylenchus* như giun tròn gây tổn thương lõi (*Pratylenchus penetrans*), giun tròn làm tổn thương rễ hoa cúc (*Pratylenchus fallax*), giun tròn làm tổn thương rễ cà phê (*Pratylenchus coffeae*), giun tròn làm tổn thương rễ chè (*Pratylenchus loosi*) và giun tròn làm tổn thương cây óc chó (*Pratylenchus vulnus*); giun tròn thuộc giống *Globodera* như giun tròn tạo kén ở cà chua vàng (*Globodera rostochiensis*) và giun tròn tạo nang ở cà chua trắng (*Globodera pallida*); giun tròn thuộc giống *Heterodera* như giun tròn tạo kén ở đậu tương (*Heterodera glycines*) và giun lươn tạo kén ở củ cải đường (*Heterodera schachtii*); giun tròn thuộc giống *Aphelenchoides* như giun tròn gây bệnh trắng đầu lúa (*Aphelenchoides besseyi*), giun tròn ở hoa cúc (*Aphelenchoides ritzemabosi*) và giun tròn ở dâu tây (*Aphelenchoides fragariae*); giun tròn thuộc giống *Aphelenchus* như giun tròn ăn nấm (*Aphelenchus avenae*); giun tròn thuộc giống *Radopholus*, như giun tròn đào hang (*Radopholus similis*); giun tròn thuộc giống *Tylenchulus* như giun tròn gây bệnh ở rễ cam quýt (*Tylenchulus semipenetrans*); giun tròn thuộc giống *Rotylenchulus* như giun tròn dạng thận (*Rotylenchulus reniformis*); giun tròn cư trú trên cây như giun tròn trong gỗ thông (*Bursaphelenchus xylophilus*) và giun tròn cắt ngang thân cây (*Bursaphelenchus cocophilus*) và giun tròn tương tự.

Các thực vật mà hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ cho chúng bao gồm các thực vật như ngũ cốc (ví dụ, lúa gạo, lúa mạch, lúa mì, lúa mạch đen, yến mạch, ngô và tương tự), đậu (đậu tương, đậu aduki, đậu, đậu răng ngựa, đậu Hà Lan, đậu phộng và tương tự), cây ăn quả/quả (táo, các loài cam quýt, lê, nho, đào,

mơ Nhật Bản, anh đào, óc chó, quả hạnh, chuối, dâu tây và tương tự), các loài rau (bắp cải, cà chua, rau bina, bông cải xanh, rau diếp, hành tây, hành lá, hạt tiêu và tương tự), cây trồng lấy rễ (cà rốt, khoai tây, khoai lang, củ cải, ngó sen, củ cải Thụy Điển và tương tự), thực vật để lấy nguyên liệu thô trong công nghiệp (bông, cây gai dầu, cây dâu giấy, cây lấy giấy mitsumata, cây cải dầu, củ cải đường, cây hublông, cây mía đường, củ cải đường, ô-liu, cao su, cây cọ, cà phê, thuốc lá, cây chè và tương tự), loài bầu bí (bí ngô, dưa chuột, dưa hấu, dưa và tương tự), các loài cỏ (cỏ chân gà, cây lúa miến, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng và tương tự), bãi cỏ (cỏ lông heo, cỏ ống và cỏ tương tự), thực vật làm gia vị, v.v. (cây oải hương, cây hương thảo, húng tây, mùi tây, hạt tiêu, gừng và tương tự) và các loài hoa (hoa cúc, hoa hồng, hoa lan và hoa tương tự).

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở 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 phòng trừ giun tròn ở khoai tây, cụ thể là *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus coffeae*, *Ditylenchus dipsaci* và *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 phòng trừ giun tròn ở 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 phòng trừ giun tròn ở 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 phòng trừ giun tròn ở 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 phòng trừ giun tròn ở 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 chalcoensis*, *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 phòng trừ giun tròn ở 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 zeae*, *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 phòng trừ giun tròn ở 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 zeae*, *Longidorus elongatus*, *Paratrichodorus lobatus*, *Trichodorus* spp., *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Globodera tabacum*, *Globodera solanacearum*, *Globodera virginiae*, *Ditylenchus dipsaci*, *Rotylenchulus* 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 phòng trừ giun tròn ở cam quýt, 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 phòng trừ giun tròn ở chuối, cụ thể là *Pratylenchus coffeae*, *Radopholus similis* và cả *Pratylenchus gibbicaudatus*, *Pratylenchus loosi*, *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus dihystra* và *Rotylenchulus* spp..

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở 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 erythraeus*, *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 phòng trừ giun tròn ở 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 phòng trừ giun tròn ở cây trồng - quả họ 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 phòng trừ giun tròn cây trồng - dạng quả hạch, cụ thể là *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Criconemella xenoplax* và *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus zae*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Xiphinema americanum*, *Criconemella curvata*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus hamatus*, *Paratylenchus projectus*, *Scutellonema brachyurum* và *Hoplolaimus galeatus*.

Các hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở cây trồng, mía và lúa gạo, cụ thể là *Trichodorus* spp., *Criconemella* spp. và cả

Pratylenchus spp., *Paratrichodorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Aphelenchoides* spp., *Heterodera* spp, *Xiphinema* spp. và *Cacopaurus* *pestis*.

Áp dụng

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng ở dạng nguyên như vậy, hoặc ví dụ ở dạng dung dịch, nhũ tương, huyền phù gốc nước hoặc gốc dầu, bột, bột thấm ướt, hồ, bột hòa tan, bụi, hạt mịn hòa tan, hạt mịn để phát tán, thể đặc huyền phù nhũ tương, 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 chất nền polyme.

Việc áp 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 ứng 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) bằng phương pháp 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 lên thực vật, các bộ phận của thực vật, quả, hạt hoặc đất sẽ phụ thuộc vào nhiều 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, rắc lên 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 sinh trưởng 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 khoảng tương đối rộng, phụ thuộc vào kiểu áp dụng. Để xử lý các bộ phận của thực vật, 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 là từ 1 đến 150 g trên 100 kg hạt, tốt hơn nữa là từ 2,5 đến 25 g trên 100 kg hạt, còn tốt hơn nữa là 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 10.000 g/ha, tốt hơn là từ 1 đến 5000 g/ha.

Các tỷ lệ áp dụng này chỉ là các ví dụ minh họa và không được dự để định giới hạn phạm vi 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, nhất là để bảo vệ các vật liệu công nghiệp chống lại sự tấn công và phá hủy của các 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 đóng cặn, đơn độc hoặc kết hợp với các thành phần hoạt tính khác.

Các vật liệu công nghiệp theo ngữ cảnh của sáng chế được hiểu nghĩa là các vật liệu vô tri vô giác mà đã được tạo ra để sử dụng trong công nghiệp. Ví dụ, các vật liệu công nghiệp mà cần được bảo vệ tránh khỏi sự biến đổi hoặc phá hủy bởi vi sinh vật có thể là các chất kết dính, keo dán, giấy, giấy dán tường và bảng/bìa cứng, hàng dệt, thảm, da, gỗ, sợi và giấy mỏng, sơn và các vật phẩm bằng chất dẻo, các vật liệu làm 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 mạch nước làm mát, các hệ thống làm mát và gia nhiệt và các bộ phận thông khí và điều hòa không khí, mà có thể bị hư hại bởi sự tăng sinh của các vi sinh vật cũng có thể được kể đến trong phạm vi của các vật liệu cần được bảo vệ. Vật liệu công nghiệp trong phạm vi của sáng chế tốt hơn là bao gồm các chất kết dính, hồ dán, giấy và thẻ, da, gỗ, sơn, chất làm trơn làm mát và các chất lỏng truyền nhiệt, tốt hơn nữa là gỗ.

Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể phòng ngừa 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 có khả năng phát triển trên hoặc trong thân gỗ.

Thân gỗ nghĩa là tất cả các loại gỗ và tất cả các dạng gia công từ gỗ này được dự định cho 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 đồ vật mà tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là thân tàu thủy, màn hình, lưới, tòa nhà, dây neo giữ thuyền và hệ thống truyền tín hiệu, khỏi bị 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 nghĩa là các chất tự nhiên có nguồn gốc từ thực vật hoặc động vật hoặc các sản phẩm chế biến từ đó có nguồn gốc tự nhiên và mong muốn được bảo vệ trong thời gian dài. Hàng hóa lưu kho có nguồn gốc thực vật, ví dụ, thực vật hoặc các bộ phận của thực vật, như thân, lá, thân củ, hạt, quả, hột, có thể được bảo vệ ngay khi mới thu hoạch hoặc sau khi xử lý bằng cách sấy khô (trước), làm 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, da lông và lông. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể ngăn ngừa được các tác dụng bất lợi, như thối, mục, phai màu, mất màu hoặc hình thành mốc.

Các vi sinh vật có khả năng làm thoái biến hoặc làm thay đổi các vật liệu công nghiệp bao gồm, ví dụ, vi khuẩn, nấm, nấm men, tảo và các sinh vật tạo nhớt. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế tốt hơn là hoạt động chống lại nấm, đặc biệt là nấm mốc, nấm làm phai màu gỗ và nấm phá hủy gỗ (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* và *Zygomycetes*), và chống lại các sinh vật tạo nhớt 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*.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Tổng hợp các hợp chất có công thức (I)

Ví dụ điều chế 1: Điều chế 5-(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)-6-thia-4-azaspiro[2.4]hept-4-en-7-on (hợp chất I.03)

Bước 1: Điều chế methyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonyl]amino} xyclopropanecarboxylat

Trong lọ thót cổ đáy tròn dung tích 100 mL trong khí quyển trơ, dung dịch chứa 733 mg (4.33 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolidini clorua được hòa tan trong 4,3 mL diclometan được bổ sung vào dung dịch chứa 1,0 g (3,33 mmol) axit 4,5-dibromo-3-flothiophen-2-carboxylic và 2,50 mL (14,3 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin được hòa tan trong 35 mL diclometan. Sau 15 phút khuấy, 1,0 g (6,66 mmol) methyl 1-aminoxyclopropanecarboxylat hydroclorua (1:1) được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 72 giờ. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradient diclometan/etyl axetat) để tạo ra 1,24 g (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 93%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,77. (M+H) = 400.

Bước 2: Điều chế methyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonothioyl]amino} xyclopropanecarboxylat

Bổ sung 267 mg (0,66 mmol) chất phản ứng Lawesson vào dung dịch chứa 265 mg (0,65 mmol) methyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonyl]amino} xyclopropanecarboxylat trong 5 mL 1,2-dimetoxyetan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 50°C trong 42 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được pha loãng bằng diclometan và lọc qua cột Chromabond® Alumina bazơ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-

heptan/etyl axetat) để tạo ra 158 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 57%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu vàng. LogP = 3,91. (M+H) = 416.

Bước 3: Điều chế axit 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonothioyl]amino}xyclopropanecarboxylic

Bổ sung 203 mg (0,47 mmol) trimetyltin hydroxit vào dung dịch chứa 271 mg (0,47 mmol) metyl 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonothioyl]amino}xyclopropanecarboxylat trong 7 mL 1,2-dicloetan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 60°C trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được cô đặc trong áp suất giảm, hòa tan trong axetyl axetat và rửa ba lần bằng dung dịch nước axit clohydric 1,0 M. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao điều chế (gradien axetonitril/dung dịch nước axit formic (1%)) để tạo ra 135 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 54%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu vàng. LogP = 2,95. (M+H) = 402.

Bước 4: Điều chế 5-(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)-6-thia-4-azaspiro[2.4]hept-4-en-7-on (hợp chất I.03)

Dung dịch chứa 70 mg (0,17 mmol) axit 1-{[(4,5-dibromo-3-flo-2-thienyl)cacbonothioyl]amino}xyclopropanecarboxylic trong 2 mL diclometan được bổ sung 43 mg (0,22 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimide hydroclorua. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 18 giờ. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradien *n*-heptan/etyl axetat) để tạo ra 51 mg (độ tinh khiết 94%, hiệu suất 72%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu hồng nhạt. LogP = 5,08. (M+H) = 384.

Ví dụ điều chế 2: Điều chế 3-bromo-4-metyl-5-(7-oxo-6-oxa-4-azaspiro[2.4]hept-4-en-5-yl)thiophen-2-carbonitril (hợp chất I.06)

Bước 1: Điều chế axit 4-bromo-5-xiano-3-metylthiophen-2-carboxylic

Dung dịch chứa 150 mg (0,86 mmol) methyl 4-bromo-5-xyano-3-methylthiophen-2-carboxylate trong 3,9 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt 0,7 mL dung dịch nước lithi hydroxit 1,1 M (0,7 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được cẩn thận axit hóa bằng dung dịch nước axit clohydric 1.0 M ở 0°C và chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat khan, lọc và cô đặc trong áp suất giảm để tạo ra 142 mg (độ tinh khiết 97%, hiệu suất 97%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,05. (M+H) = 246.

Bước 2: Điều chế methyl 1-{[(4-bromo-5-xyano-3-methyl-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat

Dung dịch chứa 1,34 g (7,92 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolidini clorua được hòa tan trong 7,9 mL diclometan được bổ sung vào dung dịch chứa 1,50mg (6,09 mmol) axit 4-bromo-5-xyano-3-methylthiophen-2-carboxylic và 4,57 mL (26,2 mmol) *N,N*-diisopropyletylamine được hòa tan trong 50 mL diclometan. Sau 15 phút khuấy, 1,85 g (12,1 mmol) methyl 1-aminoxyclopropanecarboxylat hydroclorua (1:1) được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 72 giờ. Nước được bổ sung vào và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Cô hỗn hợp phản ứng thu được trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradien diclometan/etyl axetat) để tạo ra 1,55 g (độ tinh khiết 96%, hiệu suất 71%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,31. (M+H) = 343.

Bước 3: Điều chế axit 1-{[(4-bromo-5-xyano-3-methyl-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic

Dung dịch chứa 400 mg (1,16 mmol) methyl 1-{[(4-bromo-5-xyano-3-methyl-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat trong 8,0 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt 1,5 mL dung dịch nước lithi hydroxit 1,0 M (0,7 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được cẩn thận axit hóa đến độ pH = 1 bằng dung dịch nước axit clohydric 1,0 M ở 0°C và chiết ba lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng

phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao điều chế (gradien axetonitril/dung dịch nước axit formic (1%)) để tạo ra 301 mg (độ tinh khiết 92%, hiệu suất 72%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 1,88. (M+H) = 329.

Bước 3bis: Cách điều chế khác cho axit 1-{[(4-bromo-5-xyano-3-metyl-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic

Trong bình thót cổ đáy trong thứ nhất, dung dịch chứa 120 mg (0,48 mmol) axit 4-bromo-5-xyano-3-metylthiophen-2-carboxylic trong 4 mL diclometan khan, được bổ sung, ở nhiệt độ trong phòng, 47 μ L (0,53 mmol) oxalyl clorua và một giọt *N,N*-dimetylformamit. Sau 45 phút khuấy ở nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp phản ứng được cô đặc trong áp suất giảm và hòa tan trong 2 mL 1,4-dioxan khan để tạo ra dung dịch axyl clorua. Trong bình thót cổ đáy trong thứ hai, dung dịch chứa 134 mg (0,97 mmol) axit 1-aminoxyclopropanecarboxylic hydroclorua (1:1) trong 1 mL nước, được bổ sung 1,46 mL dung dịch nước natri hydroxit 1,0 M (1,46 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 30 phút và sau đó bổ sung từ từ vào dung dịch axyl clorua đã chuẩn bị trước đó ở 0°C. Hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 24 giờ, pha loãng bằng nước, cân thận axit hóa đến độ pH=1 bằng dung dịch nước axit clohydric 1,0 M ở 0°C và chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao điều chế (gradien axetonitril/dung dịch nước axit formic (1%)) để tạo ra 65 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 41%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 1,84. (M+H) = 329.

Bước 4: Điều chế 3-bromo-4-metyl-5-(7-oxo-6-oxa-4-azaspiro[2.4]hept-4-en-5-yl)thiophen-2-cacbonitril (hợp chất I.06)

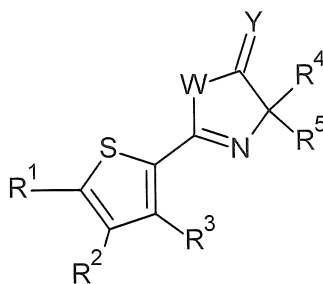
Trong lọ thót cổ đáy tròn dung tích 100 mL trong khí quyển trơ, dung dịch chứa 80 mg (0,47 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolidini clorua được hòa tan trong 0,47 mL diclometan được bổ sung vào dung dịch chứa 1,0 g (3,33 mmol) axit 1-{[(4-bromo-5-xyano-3-metyl-2-thienyl)cacbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic và 0,19 mL (1,09 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin được hòa tan trong 4 mL diclometan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Nước được bổ

sung vào và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột Chem Elut™ và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/ethyl axetat) để tạo ra 87 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 77%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 3,37. (M+H) = 311.

Các hợp chất làm ví dụ

Các hợp chất làm ví dụ theo sáng chế như được thể hiện trong bảng 1, được điều chế theo cách tương tự như trong các ví dụ trên đây và/hoặc theo mô tả chung về các quy trình được bộc lộ trong bản mô tả.

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



(I)

Bảng 1:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	LogP
I.01	Cl	Cl	Cl	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,61 ^[a]
I.02	Br	Br	CH ₃	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,65 ^[a]
I.03	Br	Br	F	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,08 ^[a]
I.04	Br	Br	Br	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,61 ^[a]
I.05	CN	Br	H	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		2,83 ^[a]
I.06	CN	Br	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3,37 ^[a]
I.07	CN	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3,25 ^[a]
I.08	Cl	Br	Br	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4,12 ^[a]

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	LogP
I.09	Cl	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4,01 ^[a]
I.10	Br	Br	CH ₃	O	O	H	propan-2-yl	5,31 ^[a]
I.11	Cl	Br	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4,39 ^[a]
I.12	Br	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		4,32 ^[a]
I.13	Br	Br	F	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4,02 ^[a]
I.14	Br	Br	I	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,61 ^[a]
I.15	Cl	Cl	CH ₃	S	O	-CH ₂ -CH ₂ -		5,53 ^[a]
I.16	Br	Br	F	O	O	CH ₃	CH ₃	3,77 ^[a]
I.17	Br	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4,51 ^[a]
I.18	Cl	Br	Br	O	O	CH ₃	CH ₃	4,32 ^[a]
I.19	Cl	Cl	CH ₃	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4,75 ^[a]
I.20	Br	Br	Cl	O	O	CH ₃	CH ₃	4,26 ^[a]
I.21	Cl	Br	Cl	O	O	CH ₃	CH ₃	4,26 ^[a]
I.22	Cl	Cl	Br	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4,55 ^[a]
I.23	Cl	Cl	Br	O	O	CH ₃	CH ₃	4,33 ^[a]
I.24	Cl	Cl	CH ₃	O	O	CH ₃	CH ₃	4,51 ^[a]
I.25	Cl	Br	Cl	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		4,47 ^[a]
I.26	CF ₃	Br	H	O	O	-CH ₂ -CH ₂ -		3,98 ^[a]

Trong bảng trên đây, việc đo các giá trị LogP được thực hiện theo EEC điều kiện 79/831 Annex V.A8 bằng HPLC (Sắc ký lỏng hiệu năng cao) trên các cột đảo pha bằng 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 chất 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 chất rửa giải (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

^[c] giá trị LogP được xác định bằng cách đo LC-UV, trong khoảng axit, với axit phosphoric 0,1% và axetonitril làm chất rửa giải (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

Nếu nhiều hơn 1 giá trị LogP thu được theo cùng phương pháp, thì tất cả các giá trị được đưa ra và được phân tách bằng ký hiệu “+”.

Việc hiệu chuẩn được thực hiện bằng các alkan-2-on mạch thẳng (có 3 đến 16 nguyên tử cacbon) với các giá trị LogP đã biết (đo các giá trị LogP sử dụng các thời gian lưu bằng phép nội suy tuyến tính giữa các alkanon liên tiếp). Các giá trị Lambda-max được xác định sử dụng phổ UV từ 200 nm đến 400 nm 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 bảng trên.

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

Danh sách 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 tế 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 có cường độ cao nhất trong phổ có thể được thể hiện.

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

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

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

Để thể hiện các tín hiệu của hợp chất trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, các đỉnh thường gặp của dung môi, ví dụ các đỉnh của DMSO trong DMSO- D_6 và đỉnh của nước được thể hiện trong danh sách đỉnh ^1H -NMR của các tác giả sáng chế và thường có giá trị trung bình 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 cường độ thấp hơn so với các đỉnh của hợp chất đích (ví dụ, với độ tinh khiết $>90\%$).

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

Chuyên gia sẽ tính toán các đỉnh của hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, và cả bằng các giá trị kỳ vọng được ước tính theo kinh nghiệm) có thể tách riêng các đỉnh của hợp chất đích khi cần tùy ý sử dụng các bộ lọc cường độ bổ sung. Việc tách riêng này có thể tương tự như việc chọn đỉnh thích hợp trong diễn giải ^1H -NMR cổ điển.

Chi tiết hơn về mô tả dữ liệu NMR với các danh sách đỉnh có thể xem trong tài liệu “Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”, Research Disclosure Database Number 564025.

Bảng A: Danh sách đỉnh NMR

I.01: ^1H-NMR(300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2987$ (10,8); $2,1192$ (4,5); $2,1089$ (4,4); $2,1021$ (8,0); $2,0880$ (16,0); $2,0759$ (8,3); $2,0305$ (1,9); $2,0261$ (1,9); $1,9807$ (8,4); $1,9686$ (15,8); $1,9549$ (8,0); $1,9477$ (4,6); $1,9374$ (4,6); $1,5961$ (10,9); $1,3212$ (0,5); $1,3136$ (0,5); $1,2911$ (0,9); $0,9182$ (0,6); $0,1076$ (0,6); $0,0474$ (0,4); $0,0366$ (14,4); $0,0257$ (0,5)
I.02: ^1H-NMR(300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2987$ (2,4); $2,5653$ (0,5); $2,5576$ (16,0); $2,5471$ (0,4); $2,1068$ (1,0); $2,0962$ (1,0); $2,0899$ (1,8); $2,0759$ (3,5); $2,0637$ (1,7); $2,0145$ (0,6); $1,9646$ (1,7); $1,9526$ (3,4); $1,9391$ (1,8); $1,9322$ (1,0); $1,9215$ (1,0); $1,5968$ (2,6); $0,0367$ (3,2)
I.03: ^1H-NMR(300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2984$ (11,1); $2,0949$ (3,4); $2,0843$ (3,6); $2,0779$ (6,5); $2,0639$ (12,5); $2,0516$ (6,1); $2,0032$ (2,0); $1,9532$ (6,4); $1,9411$ (12,0); $1,9277$ (6,5); $1,9206$ (3,6); $1,9099$ (3,5); $1,5956$ (16,0); $1,3698$ (0,5); $1,3211$ (0,7); $1,3133$ (0,4); $1,2911$ (0,7); $0,9181$ (0,4); $0,1082$ (0,5); $0,0471$ (0,5); $0,0363$ (14,1); $0,0286$ (0,4); $0,0271$ (0,4); $0,0254$ (0,5)
I.04: ^1H-NMR(499,9 MHz, d_6-DMSO): $\delta = 9,0012$ (0,5); $5,7527$ (1,2); $3,6195$ (2,9); $3,3434$ (7029,9); $3,1854$ (1,0); $3,1720$ (1,0); $3,1435$ (0,8); $3,0976$ (0,6); $3,0580$ (0,5); $3,0245$ (0,5); $3,0060$ (0,5); $2,9645$ (0,5); $2,9496$ (0,4); $2,9251$ (0,4); $2,8914$ (0,4); $2,8463$ (0,4); $2,8210$ (0,4); $2,8076$ (0,4); $2,7954$ (0,4); $2,7650$ (0,4); $2,7213$ (0,5); $2,6389$ (1,6); $2,5077$ (155,0); $2,5043$ (195,1); $2,5009$ (142,7); $2,3653$ (1,1); $2,2293$ (0,4); $2,1611$ (7,0); $2,1520$ (14,1); $2,1429$ (15,4); $2,1347$ (6,2); $2,1038$ (0,5); $2,0737$ (0,8); $2,0268$ (0,4); $2,0103$ (0,5); $1,9972$ (0,4); $1,9738$ (0,6); $1,9468$ (1,2); $1,9159$ (8,2); $1,9076$ (16,0); $1,8985$ (13,2); $1,8895$ (4,9); $1,4689$ (0,7); $1,4590$ (1,0); $1,4526$ (1,0); $1,4431$ (0,5); $1,4340$ (0,5); $1,3532$ (1,1); $1,3358$ (1,9); $1,2995$ (3,3); $1,2602$ (5,1); $1,2368$ (7,8); $1,1986$ (0,6); $1,1900$ (1,0); $1,1835$ (0,8); $1,1731$ (0,4); $0,8681$ (0,8); $0,8553$ (1,2); $0,8408$ (0,7); $0,0671$ (0,6)
I.05: ^1H-NMR(300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,6581$ (0,3); $7,6429$ (16,0); $7,2986$ (6,1); $3,9720$ (0,6); $2,0168$ (2,9); $1,9955$ (6,0); $1,9819$ (9,6); $1,9714$ (7,3); $1,9287$ (7,0); $1,9183$ (10,2); $1,9047$ (6,2); $1,8834$ (2,9); $1,6032$ (2,0); $1,2900$ (1,0); $0,9163$ (0,3); $0,0348$ (7,6)
I.06: ^1H-NMR(300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2987$ (0,8); $2,6251$ (0,5); $2,6236$ (0,6); $2,6221$ (0,6); $2,6146$ (16,0); $2,6070$ (0,6); $2,0149$ (0,8); $2,0110$ (0,5); $1,9942$ (2,0); $1,9819$ (2,9); $1,9807$ (3,2); $1,9697$ (2,0); $1,9623$ (0,9); $1,9265$ (0,9); $1,9190$ (2,1); $1,9082$ (3,4); $1,8947$ (2,0); $1,8777$ (0,6); $1,8739$ (0,8); $1,6284$ (1,1); $0,0302$ (1,0)

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

δ = 7,2986 (3,5); 2,5879 (16,0); 2,0182 (0,8); 2,0149 (0,5); 1,9974 (1,9); 1,9840 (3,1); 1,9731 (2,0); 1,9666 (0,9); 1,9303 (0,9); 1,9237 (2,0); 1,9129 (3,2); 1,8994 (2,0); 1,8819 (0,6); 1,8785 (0,8); 1,5983 (6,4); 0,0354 (4,4)

I.08: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 3,3795 (14,7); 2,5710 (4,2); 2,5680 (8,8); 2,5650 (12,0); 2,5620 (8,7); 2,5591 (4,0); 2,0232 (5,5); 2,0147 (14,0); 2,0078 (16,0); 2,0003 (6,7); 1,9739 (0,6); 1,8633 (0,6); 1,8370 (7,0); 1,8294 (15,7); 1,8225 (14,5); 1,8141 (5,5); 1,7890 (0,3)

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

δ = 7,2989 (7,8); 2,0077 (2,3); 1,9985 (2,1); 1,9878 (5,7); 1,9745 (8,8); 1,9626 (5,0); 1,9395 (1,6); 1,9145 (1,6); 1,8915 (5,3); 1,8796 (9,1); 1,8662 (5,9); 1,8556 (2,2); 1,8464 (2,5); 1,6004 (16,0); 1,2904 (0,6); 0,0362 (7,9)

I.10: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2644 (1,2); 4,2425 (2,3); 4,2333 (2,3); 2,6108 (16,0); 2,5546 (2,4); 2,3741 (0,6); 2,3649 (0,8); 2,3604 (0,9); 2,3512 (0,9); 2,3468 (0,8); 2,3375 (0,7); 2,3331 (0,4); 1,1360 (7,8); 1,1223 (7,8); 1,0501 (0,9); 1,0364 (0,9); 1,0167 (1,0); 1,0079 (7,9); 1,0032 (1,7); 0,9942 (7,8); -0,0002 (1,2)

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

δ = 7,2985 (1,6); 2,5884 (16,0); 2,5570 (0,8); 1,9390 (0,9); 1,9351 (0,6); 1,9184 (2,1); 1,9052 (3,5); 1,8943 (2,2); 1,8870 (1,0); 1,8509 (1,0); 1,8436 (2,1); 1,8327 (3,5); 1,8195 (2,2); 1,8028 (0,6); 1,7990 (0,9); 1,2896 (0,6); 0,0355 (2,0)

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

δ = 7,2985 (3,3); 2,5985 (0,4); 2,5956 (0,5); 2,5880 (16,0); 1,9424 (0,8); 1,9379 (0,6); 1,9219 (2,1); 1,9087 (3,4); 1,8978 (2,1); 1,8893 (0,9); 1,8539 (0,9); 1,8454 (2,0); 1,8344 (3,5); 1,8212 (2,1); 1,8052 (0,6); 1,8007 (0,8); 1,5899 (0,8); 1,2914 (0,7); 0,0368 (4,3)

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

δ = 7,2987 (8,5); 2,6895 (0,8); 2,6652 (2,4); 2,6537 (7,2); 2,6513 (6,4); 2,6400 (9,6); 2,6326 (4,9); 2,6271 (16,0); 2,6202 (10,6); 2,6127 (13,9); 2,6040 (8,0); 2,6005 (7,5); 2,5978 (6,9); 2,5926 (8,0); 2,5870 (7,0); 2,5817 (5,9); 2,5727 (2,5); 2,5679 (1,2); 2,5484 (1,8); 2,5433 (1,1); 2,3561 (0,3); 2,3316 (0,7); 2,3176 (3,2); 2,3156 (3,0); 2,3067 (1,0); 2,3038 (1,1); 2,2924 (8,7); 2,2874 (6,5); 2,2783 (1,8); 2,2653 (10,7); 2,2609 (7,3); 2,2469 (2,0); 2,2387 (5,6); 2,2333 (4,4); 2,2258 (1,1); 2,2131 (1,6); 2,2065 (1,5); 2,1934 (0,4); 1,6331 (7,8); 1,4095 (0,5); 1,3867 (0,5); 1,3667 (0,5); 1,3422 (0,3); 1,3181 (0,5); 1,2869 (1,1); 0,9132 (0,4); 0,1036 (0,5); 0,0433 (0,4); 0,0325 (9,9); 0,0216 (0,4)

I.14: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2986 (23,6); 3,7382 (0,3); 3,5094 (0,4); 3,3524 (0,5); 3,3279 (0,4); 2,4425 (3,0); 2,1341 (2,9); 2,1232 (3,0); 2,1171 (5,3); 2,1030 (10,2); 2,0908 (5,3); 2,0402 (1,3); 2,0380 (1,3); 1,9873 (5,2); 1,9752 (10,2); 1,9614 (5,4); 1,9549 (3,3); 1,9441 (3,0); 1,5840 (16,0); 1,3707 (0,6); 1,3378 (0,4); 1,3219 (0,9); 1,2922 (1,7); 0,9192 (0,7); 0,8962 (0,4); 0,1073 (2,2); 0,0482 (0,7); 0,0374 (23,4); 0,0265 (1,1)

I.15: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 3,5693 (0,7); 3,3138 (48,4); 2,6317 (0,4); 2,5665 (0,3); 2,4980 (51,2); 2,4387 (45,3); 2,3548 (0,6); 2,3339 (0,6); 2,3065 (0,4); 2,2891 (0,3); 2,2755 (0,4); 2,1279 (15,3); 2,1196 (14,8); 2,0799 (0,7); 1,9824 (0,4); 1,8840 (16,0); 1,8755 (13,6); 1,8375 (0,5); 1,7253 (0,4); 1,2956 (0,7); 1,2337 (2,6); 0,8540 (0,7)

I.16: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2674 (14,3); 7,2563 (2,3); 4,1785 (0,4); 4,0021 (2,8); 1,6824 (3,4); 1,6698 (3,5); 1,6424 (1,2); 1,6077 (16,0); 1,5678 (3,6); 1,5212 (597,2); 1,3938 (1,0); 1,3560 (3,8); 1,2858 (1,8); 1,2553 (3,0); 0,9172 (0,4); 0,8982 (1,4); 0,8812 (2,6); 0,8639 (1,4); 0,0721 (0,6); -0,0002 (15,4)

I.17: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 3,3215 (16,0); 2,5340 (2,2); 2,5316 (1,6); 2,5230 (3,0); 2,5200 (4,0); 2,5168 (4,1); 2,5134 (10,1); 2,5106 (12,0); 2,5076 (16,0); 2,5044 (13,6); 2,4988 (8,0); 2,4920 (2,7); 2,4879 (9,3); 2,4738 (8,5); 2,4719 (9,0); 2,4619 (2,0); 2,4587 (6,6); 2,4545 (4,5); 2,4531 (4,6); 2,4383 (2,5); 2,1235 (0,6); 2,1190 (0,5); 2,1151 (1,7); 2,1091 (2,2); 2,1047 (3,1); 2,1001 (3,6); 2,0956 (5,3); 2,0896 (5,8); 2,0852 (2,9); 2,0819 (7,3); 2,0745 (3,3); 2,0682 (4,0); 2,0635 (2,4); 2,0542 (1,3); 2,0491 (0,8)

I.18: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2611 (3,2); 1,5512 (0,3); 1,5389 (16,0); 1,4347 (0,4); 1,4274 (0,5); 1,4151 (1,3); 1,4126 (0,6); 1,4008 (0,4); 1,3772 (0,4); 1,3332 (0,5); 1,3103 (0,5); 1,2938 (1,3); 1,2845 (0,5); 1,2543 (0,8); 0,8431 (0,4); -0,0002 (3,7)

I.19: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2599 (21,2); 2,6081 (1,2); 2,5870 (2,7); 2,5664 (2,5); 2,5436 (16,0); 2,5137 (0,5); 2,2590 (0,5); 2,2509 (1,0); 2,2428 (0,8); 2,2363 (0,9); 2,2301 (1,4); 2,2200 (1,1); 2,2108 (1,0); 2,2024 (0,6); 2,1970 (0,6); 2,1913 (0,4); 1,5423 (42,4); 1,2536 (0,6); -0,0002 (25,8)

I.20: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 17,5009 (2,9); 16,6336 (2,8); 15,2703 (3,2); 13,4484 (2,9); 7,5198 (5,6); 7,3529 (3,2); 7,2606 (919,4); 7,2231 (3,4); 6,9972 (5,3); 5,0577 (2,8); 4,1584 (2,7); 3,7038 (2,9); 3,6287 (3,2); 3,6143 (3,1); 3,5946 (3,5); 3,5083 (3,9); 3,4934 (3,8); 3,4657 (4,0); 1,6997 (14,7); 1,5479 (2101,1); 1,5378 (3361,1); 1,5025 (21,8); 1,4643 (5,7); 1,4384 (4,3); 1,4261 (3,8); 1,4073 (3,8); 1,3724 (16,0); 1,3265 (3,6); 1,2584 (8,3); 0,8828 (5,8); 0,8713 (3,1); 0,1570 (4,0); 0,1455 (6,2); -0,0002 (1239,3); -0,0360 (6,4); -0,0595 (3,6); -0,0774 (2,9); -0,1496 (7,3)

I.21: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 15,1982 (3,6); 14,7931 (3,2); 7,5186 (6,4); 7,2605 (983,8); 7,2308 (4,8); 6,9968 (5,8); 5,9657 (3,2); 5,0471 (3,3); 3,9375 (3,6); 3,7611 (4,0); 3,6375 (3,5); 3,6199 (4,1); 3,5812 (3,6); 3,5386 (5,0); 3,4929 (4,7); 3,4657 (4,4); 1,7339 (4,0); 1,6987 (12,8); 1,6246 (3,9); 1,6023 (5,6); 1,5463 (2074,4); 1,5372 (2770,8); 1,4983 (11,6); 1,4883 (9,8); 1,4637 (4,4); 1,4149 (3,3); 1,3717 (16,0); 1,3542 (3,8); 1,3162 (3,3); 1,2883 (5,5); 1,2568 (8,0); 0,8786 (3,8); 0,1574 (5,6); 0,1456 (6,2); 0,0311 (4,4); -0,0002 (1311,6); -0,1494 (6,2)

I.22: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2605 (27,5); 5,2990 (1,2); 2,6557 (0,6); 2,6270 (7,7); 2,6194 (9,2); 2,6037 (16,0); 2,5831 (10,0); 2,5504 (2,0); 2,2966 (0,6); 2,2867 (1,6); 2,2794 (2,0); 2,2660 (5,1); 2,2598 (4,5); 2,2459 (7,2); 2,2401 (6,2); 2,2262 (4,7); 2,2065 (2,0); 2,1993 (1,6); 2,1889 (0,8); 1,5476 (45,2); 1,3657 (0,4); 1,3319 (0,4); 1,3191 (0,3); 1,2540 (1,3); -0,0002 (33,4)

I.23: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 16,0565 (2,1); 14,1569 (2,0); 7,5194 (3,5); 7,2919 (2,4); 7,2607 (651,9); 7,1704 (2,8); 7,1463 (2,1); 6,9973 (4,3); 4,1771 (2,2); 3,8208 (2,2); 3,6598 (2,2); 3,5711 (2,5); 3,5541 (2,0); 3,5132 (2,1); 3,4905 (2,2); 3,4777 (2,3); 3,4318 (2,3); 2,5388 (5,8); 1,6991 (11,6); 1,5761 (7,8); 1,5488 (1391,8); 1,5384 (2623,7); 1,3728 (16,0); 1,3360 (4,4); 1,3165 (3,8); 1,2965 (4,1); 1,2794 (6,6); 1,2590 (9,6); 1,2104 (2,4); 1,1242 (2,1); 0,8977 (3,2); 0,8819 (6,9); 0,8635 (4,0); 0,1575 (2,8); 0,1448 (4,7); 0,0695 (46,9); -0,0002 (872,7); -0,1153 (2,6); -0,1320 (2,4); -0,1501 (5,7)

I.24: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2605 (8,0); 2,5391 (16,0); 1,5476 (15,8); 1,5163 (30,3); -0,0002 (10,7)

I.25: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2603 (41,8); 5,2990 (0,5); 2,6521 (0,5); 2,6251 (7,4); 2,6176 (8,6); 2,6017 (16,0); 2,5811 (9,5); 2,5491 (1,8); 2,3147 (0,3); 2,2959 (0,7); 2,2861 (1,5); 2,2765 (2,1); 2,2651 (4,0); 2,2569 (3,9); 2,2453 (5,8); 2,2373 (5,2); 2,2256 (4,2); 2,2188 (3,3); 2,2055 (1,9); 2,1968 (1,4); 2,1895 (0,8); 1,5463 (69,6); 1,4758 (0,7); 1,4652 (0,6); 1,3558 (0,6); 1,3357 (0,6); 1,3185 (0,6); 1,2846 (0,6); 1,2549 (2,8); 1,2333 (0,8); 0,8607 (0,4); 0,8450 (0,4); 0,8327 (0,4); 0,0691 (1,1); -0,0002 (50,0); -0,1495 (0,3)

I.26: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5983 (11,2); 7,2611 (8,5); 1,9425 (3,6); 1,9368 (3,8); 1,9275 (9,3); 1,9179 (15,9); 1,9089 (8,6); 1,8958 (3,2); 1,8736 (3,0); 1,8604 (8,3); 1,8516 (16,0); 1,8418 (9,7); 1,8327 (4,1); 1,8268 (4,0); 1,5528 (12,1); -0,0002 (11,2)

Dữ liệu sinh học

Ví dụ A được mô tả sau đây thể hiện sự cảm ứng biểu hiện gen phòng vệ ở *Arabidopsis thaliana* bởi Các hợp chất có công thức (I), cụ thể là sự kích thích con đường axit salixylic. Do đó, các hợp chất này có thể cảm ứng cơ chế phòng vệ của vật chủ và vì vậy bảo vệ thực vật chống lại phạm vi rộng các mầm bệnh bao gồm vi khuẩn và nấm.

Các ví dụ B và C được mô tả sau đây thể hiện sự bất hoạt *in vitro* trực tiếp trong thử nghiệm tế bào của các hợp chất có công thức (I) chống lại các mầm bệnh khác nhau bao gồm vi khuẩn và nấm, do đó minh họa cách thức hoạt động của các hợp chất có công thức (I) dưới dạng chất cảm ứng hệ thống phòng vệ của vật chủ.

Các ví dụ D, E, F và G được mô tả sau đây thể hiện hoạt tính *in vivo* của các hợp chất *in planta* có công thức (I) bằng cách kích thích hệ thống phòng vệ của thực vật chống lại các mầm bệnh khác nhau gây nhiễm trên thực vật bao gồm vi khuẩn và nấm.

Các ví dụ H, I và J được mô tả sau đây thể hiện hoạt tính *in vivo in planta* của hợp chất so sánh, CMP1, được điều chế theo mô tả của WO2004/062361 và của các hợp chất theo sáng chế. Hợp chất so sánh CMP1 khác về mặt cấu trúc so với các hợp chất theo sáng chế ở chỗ R^3 là hydro trong khi đó R^1 và R^2 là halogen (brom). Việc so sánh hoạt tính của CMP1 với hoạt tính của các hợp chất theo sáng chế thể hiện

rằng hợp chất đối chứng này rõ ràng hoạt động kém hơn và do đó không tạo ra hiệu quả kỹ thuật có lợi như của các hợp chất theo sáng chế.

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

Thực vật thông báo *Arabidopsis thaliana* chứa trình tự mã hóa protein huỳnh quang xanh lục (green fluorescent protein - GFP) được liên kết với trình tự khởi đầu đáp ứng 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 lớn hơn 2 ở nồng độ hợp chất là 300 ppm: I.01; I.02; I.03; I.04; I.06; I.07; I.08; I.09; I.12; I.15; I.16; I.17.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện giá trị phát huỳnh quang tương đối ít nhất là lớn hơn 2 ở nồng độ hợp chất là 75 ppm: : I.02; I.06; I.07; I.08; I.09; I.11; I.16; I.17.

Salixylat là hormon phòng vệ chính chống lại 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 phạm vi rộng các mầm bệnh.

Ví dụ B: Thử nghiệm tế bào *Colletotrichum lindemuthianum* in vitro

Dung môi: DMSO

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

Thành phần cấy: Huyền phù bào tử

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

Huyền phù bào tử của *C. lindemuthianum* được điều chế 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 6 ngày ủ, độc tính kháng nấm của các hợp chất được xác định bằng cách đo 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 không thể hiện hoạt tính trực tiếp (hiệu lực thấp hơn hoặc bằng 30%) ở nồng độ 20 ppm thành phần hoạt tính: I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.19; I.20; I.21; I.22; I.23; I.24; I.25.

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

Dung môi:	DMSO
Môi trường nuôi cấy:	Canh trường LB (Luria Broth Miller) Sigma
Thành phần 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 $\leq 1\%$.

Thành phần cấy được chuẩn bị từ sản phẩm nuôi cấy sơ bộ chứa vi khuẩn sinh trưởng trong môi trường lỏng và được pha loãng đến mật độ quang (OD) mong muốn.

Các hợp chất được đánh giá về khả năng của chúng trong việc ức chế sự sinh trưởng 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 các 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 ở các giếng chứa các hợp chất với độ hấp thụ ở các giếng đối chứng không chứa các thành phần hoạt tính.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế không thể hiện hoạt tính trực tiếp (hiệu lực thấp hơn hoặc bằng 30%) ở nồng độ 20 ppm thành phần hoạt tính: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.19; I.20; I.21; I.22; I.23; I.24; I.25.

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

Các thành phần hoạt tính được thử nghiệm được chuẩn bị bằng cách đồng hóa trong hỗn hợp axeton/dimetyl sulfoxit/tween®, và sau đó pha loãng bằng nước để thu được nồng độ hoạt chất mong muốn.

Các cây đậu non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được chuẩn bị như đã mô tả trên đây. Thực vật đối chứng chỉ được xử lý bằng dung dịch nước 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 *Colletotrichum lindemuthianum*. Các cây đậu đã bị 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 thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.26.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.07; I.12.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.06; I.08; I.09; I.11; I.13.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.09; I.25.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.22.

Ví dụ E: Thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Peronospora parasitica* (gây bệnh sương mai trên cây họ cải)

Các thành phần hoạt tính được thử nghiệm được chuẩn bị bằng cách đồng hóa trong hỗn hợp axeton/dimetyl sulfoxit/tween®, và sau đó pha loãng bằng nước để thu được nồng độ hoạt chất mong muốn.

Cây bắp cải non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được chuẩn bị như đã mô tả trên đây. Thực vật đối chứng chỉ được xử lý bằng dung dịch nước axeton/dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, các cây được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước chứa bào tử *Peronospora parasitica*. Các cây bắp cải đã gây nhiễm được ủ trong 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 thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.01; I.20; I.24.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.16; I.17; I.19; I.21; I.22; I.26.

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

Các thành phần hoạt tính được thử nghiệm được chuẩn bị bằng cách đồng hóa trong hỗn hợp axeton/dimetyl sulfoxit/tween®, và sau đó pha loãng bằng nước để thu được nồng độ hoạt chất mong muốn.

Cây bắp cải non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được chuẩn bị như đã mô tả trên đây. Thực vật đối chứng chỉ được xử lý bằng dung dịch nước axeton/dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, các cây được gây nhiễm bằng cách phun lên lá huyền phù nước chứa vi khuẩn *Xanthomonas campestris pv. campestris*. Các cây bắp cải 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 thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.03; I.09; I.11; I.12; I.26.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.01; I.08.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.06; I.13.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.03; I.08; I.15.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.02; I.13.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.06; I.11; I.12.

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

Các thành phần hoạt tính được thử nghiệm được chuẩn bị bằng cách đồng hóa trong hỗn hợp axeton/dimetyl sulfoxit/tween®, và sau đó pha loãng bằng nước để thu được nồng độ hoạt chất mong muốn.

Các cây đậu non được xử lý bằng cách phun thành phần hoạt tính được chuẩn bị như đã mô tả trên đây. Thực vật đối chứng chỉ được xử lý bằng dung dịch nước axeton/dimetyl sulfoxit/tween®.

Sau 72 giờ, các cây được gây nhiễm bằng cách phun lên lá bằng huyền phù nước chứa các bào tử *Uromyces appendiculatus*. Các cây 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 thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.02.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.15.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.01; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.26.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.06; I.23.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.11; I.20.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.08; I.09; I.16; I.19; I.21; I.22; I.25.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.06; I.20.

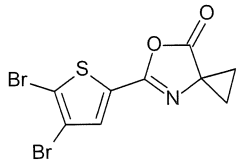
Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 125 ppm thành phần hoạt tính: I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.16; I.17; I.19; I.21; I.22; I.24; I.25.

Ví dụ H: Các ví dụ so sánh

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

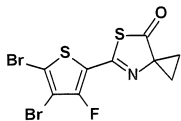
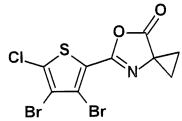
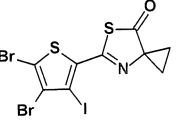
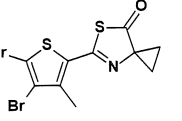
Hợp chất CMP1 được điều chế theo mô tả trong WO2004/062361.

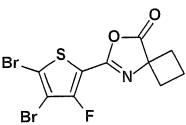
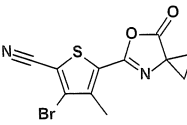
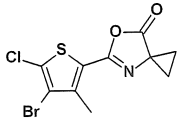
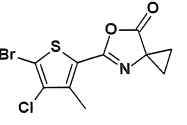
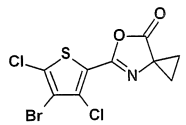
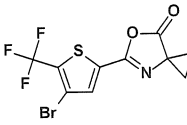
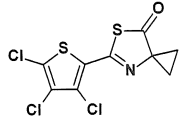
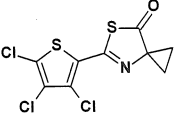
Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Hiệu lực (%) ở 125 ppm	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP1		37*	35*

*Giá trị trung bình cộng của 4 thử nghiệm

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo
I.03		I.08		I.15		I.02	

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo
I.13		I.06		I.11		I.12	
I.09		I.26		I.01		I.01	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 125 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 125 ppm, các hợp chất I.03; I.08; I.15 thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79%, các hợp chất I.02; I.13 thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% và các hợp chất I.06; I.11; I.12 thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% trong khi đó CMP1 thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

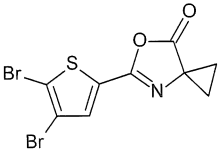
Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, các hợp chất I.03; I.09; I.11; I.12; I.26 thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79%, các hợp chất I.01; I.08 thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% và các hợp chất I.06; I.13 thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% trong khi đó CMP1 thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

Ví dụ I: Các ví dụ so sánh

Hợp chất CMP1 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Uromyces appendiculatus* (gây bệnh gỉ sắt ở đậu) trong cùng điều kiện như được mô tả trong ví dụ G.

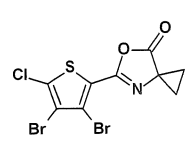
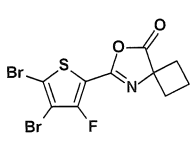
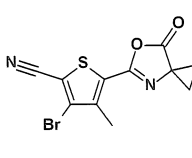
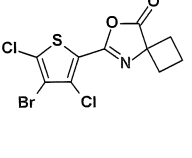
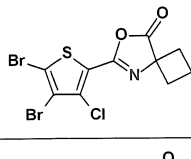
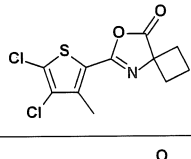
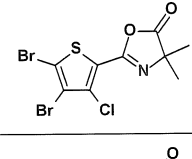
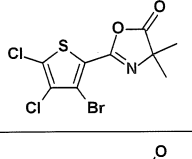
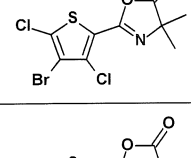
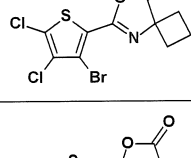
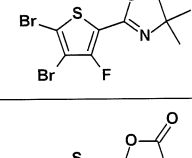
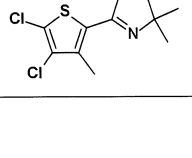
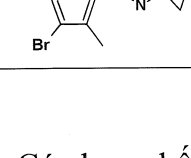
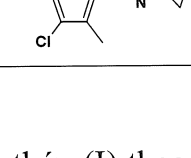
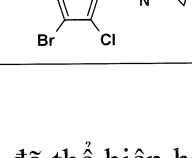
Hợp chất CMP1 được điều chế theo mô tả trong WO2004/062361.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Hiệu lực (%) ở 125 ppm	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP1		42*	32*

*Giá trị trung bình cộng của 3 thử nghiệm

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo
I.08		I.13		I.06		I.25	
I.17		I.19		I.20		I.23	
I.21		I.22		I.16		I.24	
I.11		I.12		I.09			

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 125 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 125 ppm, các hợp chất I.06; I.20 thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% và các hợp chất I.08; I.09; I.11; I.12; I.13; I.16; I.17; I.19; I.21; I.22; I.24; I.25 thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% trong khi đó CMP1 thể hiện hiệu lực là 42% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

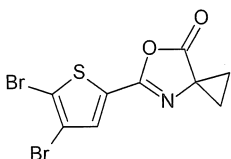
Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, các hợp chất I.06; I.23 thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79%, các hợp chất I.11; I.20 thể hiện hiệu lực từ 80% đến 89% và các hợp chất I.08; I.09; I.16; I.19; I.21; I.22; I.25 thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% trong khi đó CMP1 thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

Ví dụ J: Các ví dụ so sánh

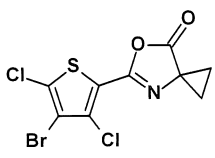
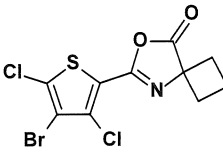
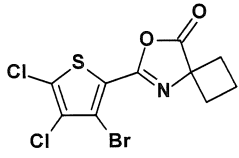
Hợp chất CMP1 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (gây bệnh thán thư trên đậu) ở cùng điều kiện như được mô tả trong ví dụ D.

Hợp chất CMP1 được điều chế theo mô tả trong WO2004/062361.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Công thức cấu tạo	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP1		19

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc.

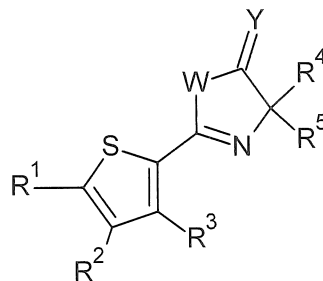
Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo	Ví dụ	Công thức cấu tạo
I.09		I.25		I.22	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, các hợp chất I.09; I.25 thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% và hợp chất I.22 thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% trong khi đó CMP1 thể hiện hiệu lực dưới 20% ở cùng nồng độ.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):



(I)

hoặc muối, N-oxit và solvat của chúng,

trong đó

R^1 , R^2 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl;

R^3 được chọn từ nhóm gồm halogen và C_1 - C_6 -alkyl;

W, Y độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm oxy, lưu huỳnh;

R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, aryl- C_1 - C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 , trong đó các gốc R^4 , R^5 không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều R^a phần tử thế và trong đó các gốc R^4 , R^5 vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b ; hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 hoặc dị vòng 3- đến 6-cạnh, trong đó vòng cacbon C_3 - C_6 và dị vòng 3- đến 6-cạnh này có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^b , R^a độc lập được chọn từ nhóm gồm nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluoro- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_3 - C_7 -halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylamino, di- C_1 - C_8 -alkylamino, C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_8 -halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfanyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, di- C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl, C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkoxycarbonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen,

C₁-C₈-alkylcabconyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcabconyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcabconylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcabconylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl; C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl, R^b độc lập được chọn từ nhóm gồm nguyên tử halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluor- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₇-xycloalkyl, C₁-C₈-halogenoalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₃-C₇-halogenoxycloalkyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₈-alkylamino, di-C₁-C₈-alkylamino, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₈-halogenoalkoxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcabconyl, C₁-C₈-halogenoalkylcabconyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbamoyl, di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, C₁-C₈-alkoxycabconyl, C₁-C₈-halogenoalkoxycabconyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcabconyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcabconyloxy có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcabconylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcabconylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có 1 đến 5 nguyên tử halogen, sulfamoyl, C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl;

với điều kiện nếu R¹ là halogen và R² là halogen, R³ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano, C₁-C₆-alkyl hoặc C₁-C₆-haloalkyl;

với điều kiện nếu R¹ và R² giống nhau và đều là brom hoặc clo, W là lưu huỳnh hoặc R⁴ và R⁵ không cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành xyclopropyl.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R¹ được chọn từ nhóm gồm halogen, xyano.
3. Hợp chất theo điểm 1 hoặc 2, trong đó R² là halogen.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3-C_6 .
5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó W là oxy.
6. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, trong đó Y là oxy.
7. Chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 và ít nhất một chất phụ trợ thích hợp trong nông nghiệp.
8. Phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm ở thực vật bao gồm bước đưa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6 hoặc chế phẩm theo điểm 7 lên thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc lên đất trong đó thực vật sinh trưởng.