



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11) 
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ
1-0050569
(51)^{2021.01} C07D 333/38; A01N 43/34; C07D (13) B
409/12; A01N 43/10; A01N 43/50

(21) 1-2022-04470 (22) 17/12/2020
(86) PCT/EP2020/086745 17/12/2020 (87) WO 2021/122976 24/06/2021
(30) 19218677.3 20/12/2019 EP
(45) 25/08/2025 449 (43) 26/09/2022 414A
(73) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)
Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany
(72) DUFOUR, Jeremy (FR); NICOLAS, Lionel (FR); KNOBLOCH, Thomas (FR);
BRUNET, Stephane (FR); LAMPRECHT, Sybille (DE).
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT LÀ DẪN XUẤT THIOPHEN CARBOXAMIT ĐƯỢC THỂ, CHẾ
PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ CÁC BỆNH
DO VI KHUẨN VÀ/HOẶC NẤM Ở THỰC VẬT

(21) 1-2022-04470

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất là dẫn xuất thiophen carboxamit được thế, chế phẩm chứa hợp chất này và phương pháp phòng trừ bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm ở thực vật bằng hợp chất và chế phẩm này.

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.

Tài liệu EP0450355 mô tả các dẫn xuất thiophencarboxamit hữu dụng để bảo vệ thực vật khỏi sự tấn công của các vi sinh vật gây hại thực vật.

Tài liệu GB1241589 mô tả các dẫn xuất thiophen để sử dụng trong nông nghiệp bao gồm việc sử dụng chúng làm thuốc diệt nấm ở thực vật.

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* metyl, etyl, *n*-propyl, *iso*-propyl, *n*-butyl, *iso*-butyl, *tert*-butyl, *sec*-butyl, pentyl, *iso*-pentyl, hexyl, heptyl, octyl, nonyl và detyl và các chất đồng phân 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-metyl-prop-2-en-1-yl, hoặc 2-metyl-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 phần tử thế 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 là, haloalkyl này là, *ví dụ* clometyl, flopropyl, flometyl, diflometyl, triclometyl, 2,2,2-trifloetyl, pentaflloetyl, bromobutyl, triflometyl, iodoetyl, và các chất đồng phân của chúng.

Thuật ngữ “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-difloetoxo, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2-floetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, 2,2-diclo-2-floetoxo, 2,2,2-tricloetoxo, pentaflometoxy 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 các 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 (alkyl)-S(=O)₂-, trong đó thuật ngữ “alkyl” là như được xác định trong bản mô tả. Ví dụ về C₁-C₈-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-

dimethylpropylsulfonyl, hexylsulfonyl, 1-methylpentylsulfonyl, 2-methylpentylsulfonyl, 3-methylpentylsulfonyl, 4-methylpentylsulfonyl, 1,1-dimethylbutylsulfonyl, 1,2-dimethylbutylsulfonyl, 1,3-dimethylbutylsulfonyl, 2,2-dimethylbutylsulfonyl, 2,3-dimethylbutylsulfonyl, 3,3-dimethylbutylsulfonyl, 1-ethylbutylsulfonyl, 2-ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-trimethylpropylsulfonyl, 1-ethyl-1-methylpropylsulfonyl và 1-ethyl-2-methylpropylsulfonyl.

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

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

Thuật ngữ “haloalkoxycacybonyl” như được sử dụng ở đây chỉ alkoxycacybonyl 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 liên kế 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 có thể là hệ vòng thơm đơn vòng hoặc đa vòng (ví dụ, hai vòng hoặc ba vòng) ngưng tụ. Ví dụ về aryl bao gồm, nhưng không giới hạn ở, phenyl, azulenyl, naphthyl và florenyl. Cũng cần hiểu rằng khi nhóm aryl này được thể bằng một hoặc nhiều phân tử thế, thì (các) phân 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) phân 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 phân tử thế phức hợp (ví dụ, aryloxy).

Thuật ngữ “aralkyl” như được sử dụng trong bản mô tả này chỉ C_1 - C_6 -alkyl được thể bằng aryl như được xác định trong bản mô tả này. Ví dụ về aralkyl bao gồm nhóm benzyl ($-CH_2-C_6H_5$).

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 “ C_1 - C_6 ”, ví dụ trong ngữ cảnh của định nghĩa về “ C_1 - C_6 -alkyl”, hoặc “ C_1 - C_6 -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.

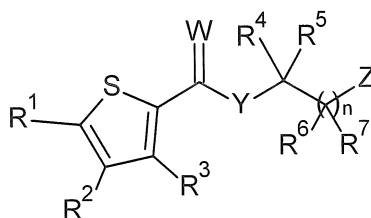
Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “ C_1 - C_8 ”, ví dụ trong ngữ cảnh của định nghĩa về “ C_1 - C_8 -alkyl”, hoặc “ C_1 - C_8 -alkoxy”, cần được hiểu nghĩa là nhóm có số nguyên tử cacbon hữu hạn từ 1 đến 8, tức là 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 hoặc 8 nguyên tử cacbon.

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

mỗi R^1 , R^2 và R^3 là clo;

R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, halogen, xyano, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -hydroxyalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl, -O-C(=O)- C_1 - C_6 -alkyl, vòng cacbon C_3 - C_6 , heterocyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), -C(=O)-N(C_1 - C_6 -alkyl)₂, -C(=O)-OH, -C(=O)-O- C_1 - C_6 -alkyl, aryl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh, - C_1 - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -alkoxy, - C_1 - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -haloalkyl, - C_1 - C_6 -alkyl- vòng cacbon C_3 - C_6 , - C_1 - C_6 -alkyl-heterocyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, - C_1 - C_6 -alkyl-aryl, - C_1 - C_6 -alkyl-hydroxyaryl, - C_1 - C_6 -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, - C_1 - C_6 -alkyl-S- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-O-(C=O)- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-C(=O)-NH₂, - C_1 - C_6 -alkyl-C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), - C_1 - C_6 -alkyl-C(=O)-N(C_1 - C_6 -alkyl)₂, - C_1 - C_6 -alkyl-C(=O)-OH, - C_1 - C_6 -alkyl-C(=O)-O- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-NH-C(=NH)-NH₂, -S- C_1 - C_6 -alkyl, -S-C(=O)- C_1 - C_6 -alkyl, -S-C(=O)-O- C_1 - C_6 -alkyl, -S-C(=S)-O- C_1 - C_6 -alkyl, -S-C(=O)-S- C_1 - C_6 -alkyl, -S-C(=O)-NH₂, -S-C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), -S-C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl)₂, -S-C(=S)-NH₂, -S-C(=S)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), -S-C(=S)-NH(C_1 - C_6 -alkyl)₂, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)-O- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)-S- C_1 - C_6 -alkyl, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)-NH₂, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=O)-NH(C_1 - C_6 -alkyl)₂, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=S)-NH₂, - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=S)-NH(C_1 - C_6 -alkyl), - C_1 - C_6 -alkyl-S-C(=S)-NH(C_1 - C_6 -alkyl)₂, trong đó các gốc R_4 , R_5 vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phân tử thế R^x , trong đó ít nhất

một trong số R^4 và R^5 là hydro, C_1 - C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 , 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^x , trong đó R^x độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluoro- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_1 - C_8 -halogenoalkyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_3 - C_7 -halogenoxycloalkyl có từ 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 từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfanyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl có từ 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 từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonyloxy, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyloxy có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylcarbonylamino, C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonylamino có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfanyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfinyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfinyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1 - C_8 -alkylsulfonyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfonyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen; C_1 - C_8 -alkylsulfonylamino, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfonylamino có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl; C_1 - C_8 -alkylsulfamoyl và di- C_1 - C_8 -alkylsulfamoyl;

R^6 và R^7 độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, vòng cacbon C_3 - C_6 hoặc R^6 và R^7 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3 - C_6 hoặc dị vòng 3 đến 6 cạnh;

n là 0 hoặc 1;

W là oxy hoặc lưu huỳnh;

Y là NR^8 với R^8 là hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, hydroxy, C_1 - C_6 -alkoxy hoặc vòng cacbon C_3 - C_6 ;

Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)-OR^a$, $-C(=O)-SR^a$, $-C(=O)-NR^bR^c$, $-C(=S)-NR^bR^c$ hoặc $-C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a$, trong đó R^a được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -haloalkyl, C_1-C_6 -xyanoalkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_3-C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-Si(C_1-C_6 -alkyl) $_3$, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_3-C_8 -xycloalkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh và $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, hoặc R^a có thể cùng với R_4 và với các nguyên tử mà chúng gắn vào, tạo thành dị vòng 4 đến 7 cạnh, R^b và R^c độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, hydroxyl, C_1-C_6 -alkoxy, xyano, C_1-C_6 -xyanoalkyl, hoặc R^b có thể cùng với R^4 và với các nguyên tử mà chúng gắn vào, tạo thành dị vòng 4 đến 7 cạnh, R^d và R^e độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, xyano, hydroxyl, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, $-O-C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, vòng cacbon C_3-C_6 , $-C(=O)-NH_2$, $-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C(=O)-N(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C(=O)-OH$, $-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, aryl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C_3-C_6 , $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-O- $C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-N(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-OH$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $NH-C(=NH)-NH_2$, trong đó ít nhất một trong số R^d và R^e là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3-C_6 , hoặc R^d và R^e cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành carbonyl, vòng cacbon C_3-C_6 , hoặc dị vòng 3 đến 6 cạnh;

miễn là 3,4,5-triclo-*N*-(2-xyanoetyl)-*N*-xyclohexylthiophen-2-carboxamit [24504-23-2], 3,4,5-triclo-*N,N*-bis(2-xyanoetyl)thiophen-2-carboxamit [24467-28-5], và 3,4,5-triclo-*N*-(2-xyanoetyl)-*N*-metylthiophen-2-carboxamit [24417-82-1] được loại trừ khỏi các hợp chất có công thức (I),

trong đó nếu W là oxy, và Y là NR^8 , với R^8 là hydro hoặc C_1-C_6 -alkyl, và $n = 0$, và R^4 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -alkyl-aryl, C_1-C_6 -alkyl-hydroxyaryl, xyclopropyl và R^5 là hydro hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành xyclopropyl, sau đó Z được chọn từ

nhóm bao gồm $-C(=O)-SR^a$, $-C(=O)-NR^bR^c$, $-C(=S)-NR^bR^c$, $-C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a$.

Một phương án được ưu tiên, trong đó R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, vòng cacbon C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, C_3-C_6 -, aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C_3-C_6 , C_1-C_6 -alkyl- $O-(C=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-OH$; $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $S-C_1-C_6$ -alkyl, trong đó ít nhất một trong số R^4 và R^5 là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3-C_6 và n là 0, và W là oxy, và nếu Y là NR^8 , trong đó R^8 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, sau đó Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)-SR^a$, $-C(=S)-NR^bR^c$ hoặc $-C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a$.

Cũng được ưu tiên là phương án trong đó R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C_3-C_6 , $C(=O)-OH$, $-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C_3-C_6 , $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $S-C_1-C_6$ -alkyl-, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-OH$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl; hoặc R^4 và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C_3-C_6 .

Theo một phương án ưu tiên khác, trong đó W là oxy.

Được ưu tiên hơn nữa là phương án trong đó Y là NR^8 với R^8 là C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -haloalkyl, C_1-C_6 -xyanoalkyl, hydroxy, C_1-C_6 -alkoxy hoặc vòng cacbon C_3-C_6 , và trong đó Y tốt hơn là NR^8 với R^8 là hydro.

Theo một phương án ưu tiên khác Z được chọn từ nhóm bao gồm xyano, $-C(=O)-SR^a$, $-C(=S)-NR^bR^c$ hoặc $-C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a$, và tốt hơn là Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)-OR^a$, $C(=O)-NR^bR^c$.

Một phương án khác được ưu tiên, trong đó

trong đó R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C_3-C_6 , $C(=O)-OH$, $-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C_3-C_6 , $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $S-C_1-C_6$ -alkyl-, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-OH$, $-C_1-C_6$ -

alkyl-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyl; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆.

R⁶ và R⁷ là hydro hoặc R⁶ và R⁷ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃;

W là oxy;

Y là NR⁸ với R⁸ là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, hydroxy, C₁-C₆-alkoxy hoặc vòng cacbon C₃-C₆;

n là 0 hoặc 1;

Z được chọn từ nhóm bao gồm -C(=O)-SR^a, -C(=S)-NR^bR^c hoặc -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a, và tốt hơn là Z được chọn từ nhóm bao gồm -C(=O)-OR^a, C(=O)-NR^bR^c.

Một phương án khác được ưu tiên, trong đó

trong đó R⁴ và R⁵ độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-hydroxyalkyl, vòng cacbon C₃-C₆, C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁-C₆-alkyl, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alkoxy, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-haloalkyl, -C₁-C₆-alkyl-vòng cacbon C₃-C₆, -C₁-C₆-alkyl-aryl, -C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryl, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyl-, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-OH, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyl; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆.

R⁶ và R⁷ là hydro hoặc R⁶ và R⁷ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃;

W là oxy.

Y là NR⁸ với R⁸ là hydro;

n là 0 hoặc 1;

Z được chọn từ nhóm bao gồm -C(=O)-SR^a, -C(=S)-NR^bR^c hoặc -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a, và tốt hơn là Z được chọn từ nhóm bao gồm -C(=O)-OR^a, C(=O)-NR^bR^c.

Một phương án khác được ưu tiên, trong đó

trong đó R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C_3 - C_6 , $C(=O)$ -OH, $-C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -alkoxy, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -haloalkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-vòng cacbon C_3 - C_6 , $-C_1$ - C_6 -alkyl-aryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-S- C_1 - C_6 -alkyl-, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -NH₂, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -OH, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl; hoặc 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 NR^8 với R^8 là hydro;

n bằng 0;

Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)$ -SR^a, $-C(=S)$ -NR^bR^c hoặc $-C(=O)$ -NH-CR^dR^e- $C(=O)$ -OR^a, và tốt hơn là Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)$ -OR^a, $C(=O)$ -NR^bR^c.

Một phương án khác được ưu tiên, trong đó

trong đó R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C_3 - C_6 , $C(=O)$ -OH, $-C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -alkoxy, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -haloalkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-vòng cacbon C_3 - C_6 , $-C_1$ - C_6 -alkyl-aryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-S- C_1 - C_6 -alkyl-, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -NH₂, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -OH, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl; hoặc 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 NR^8 với R^8 là hydro;

n bằng 0;

Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)$ -OR^a, $C(=O)$ -NR^bR^c.

Theo một phương án, R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl, $-O$ - $C(=O)$ - C_1 - C_6 -alkyl, heterocyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C(=O)$ -NH₂, $-C(=O)$ -NH(C_1 - C_6 -alkyl), $-C(=O)$ -N(C_1 - C_6 -alkyl)₂, $-C(=O)$ -OH, $-C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh, -

C_1-C_6 -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-NH₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-NH(C_1-C_6 -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-N(C_1-C_6 -alkyl)₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-O- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-NH-C(=NH)-NH₂, $-S-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=S)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-S-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-NH_2$, $-S-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-S-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl)₂, $-S-C(=S)-NH_2$, $-S-C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-S-C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl)₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)-O- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)-S- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)-NH₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)-NH(C_1-C_6 -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=O)-NH(C_1-C_6 -alkyl)₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=S)-NH₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=S)-NH(C_1-C_6 -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl-S-C(=S)-NH(C_1-C_6 -alkyl)₂; trong đó các gốc R₄, R₅ vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^x, trong đó ít nhất một trong số R⁴ và R⁵ là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C₃-C₆. Theo một phương án, R⁴ và R⁵ độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C₃-C₆, aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C₃-C₆, C_1-C_6 -alkyl-O-(C=O)- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-OH; $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- C_1-C_6 -alkyl, trong đó gốc R₄, R₅ không vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^w, trong đó gốc R₄, R₅ vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^x, trong đó ít nhất một trong số R⁴ và R⁵ là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C₃-C₆; 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 này là dị vòng 3 đến 6 cạnh có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^x. Theo một phương án khác R⁴ là hydro, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C₃-C₆, C(=O)-OH, -C(=O)-O- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C₃-C₆, $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- C_1-C_6 -alkyl-, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-NH₂, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-OH, $-C_1-C_6$ -alkyl-C(=O)-O- C_1-C_6 -alkyl, R₅ là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C₃-C₆; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆. Theo một phương án khác R⁴ là hydro, C_1-C_6 -alkyl, vòng cacbon C₃-C₆, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C₃-C₆, $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- C_1-C_6 -alkyl-, R₅ là hydro hoặc C_1-C_6 -alkyl; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà

chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆. Theo một phương án khác R⁴ là hydro, C₁-C₆-alkyl, vòng cacbon C₃-C₆, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-haloalkyl, -C₁-C₆-alkyl-vòng cacbon C₃-C₆, -C₁-C₆-alkyl-aryl, -C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryl, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyl-, R₅ là hydro hoặc C₁-C₆-alkyl. Theo một phương án khác 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. Theo một phương án khác R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆. Theo một phương án khác R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành cyclopropyl hoặc cyclobutyl.

Theo một phương án khác n là 0. Theo một phương án khác n là 1.

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

Theo một phương án khác Y là NR⁸ với R⁸ là hydro. Theo một phương án khác Y là NR⁸ với R⁸ là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, hydroxy, C₁-C₆-alkoxy hoặc vòng cacbon C₃-C₆.

Theo một phương án khác Z được chọn từ nhóm bao gồm -C(=O)-SR^a, -C(=S)-NR^bR^c hoặc -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a. Theo một phương án khác Z là -C(=O)-OR^a hoặc C(=O)-NR^bR^c. Theo một phương án khác Z là -C(=O)-OR^a. Theo một phương án khác Z là -C(=O)-NR^bR^c.

Các định nghĩa cụ thể nêu trên về R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, W, Y, Z và n có thể được kết hợp theo nhiều cách khác nhau để tạo ra nhiều phân lớp của hợp chất theo sáng chế.

Bản mô tả không bao hàm các hợp chất thu được từ các tổ hợp trái với quy luật tự nhiên và do đó người có hiểu biết trung bình về lĩnh vực này 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 liền kề được loại trừ.

Tùy thuộc vào bản chất của phân tử thể, hợp chất có công thức (I) hoặc (II) có thể xuất hiện ở dạng các chất đồng phân lập thể khác nhau. Các chất đồng phân lập thể này là, ví dụ, chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atrop hoặc chất đồng phân hình học. Do đó, sáng chế bao gồm cả các chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ của các chất đồng phân này. Khi một hợp

chất có thể xuất hiện ở hai hoặc nhiều dạng hổ biến ở trạng thái cân bằng, việc đề cập đến hợp chất này bằng cách mô tả một chất hổ biến được cho là bao gồm tất cả các dạng hổ 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 phần 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) hoặc (II) có thể thích hợp ở dạng tự do, dạng muối, dạng N-oxit hoặc dạng solvat của nó (ví dụ, hydrat).

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

Muối có hoạt tính hóa nông bao gồm muối cộng axit của axit vô cơ và hữu cơ cũng như muối của các bazơ thông thường. Ví dụ về 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 thioxynic, 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 (II) 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) hoặc (II) có thể tồn tại ở nhiều dạng tinh thể và/hoặc dạng vô định hình. Dạng tinh thể bao gồm dạng tinh thể chưa được solvat hóa, solvat và hydrat.

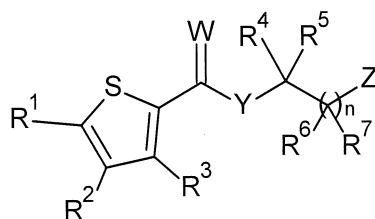
Sáng chế đề cập đến hợp chất bất kỳ có công thức (I) được mô tả trong bảng cũng như việc sử dụng chúng trong bảo vệ cây trồng (ví dụ để phòng trừ nấm và/hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật trên thực vật hoặc bộ phận của thực vật).

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 ở cây trồng 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.

Một khía cạnh khác của sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất có công thức (I):



(I)

trong đó

mỗi R^1 , R^2 và R^3 là clo;

R^4 và R^5 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm hydro, halogen, xyano, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -hydroxyalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl, -O-

$C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, vòng cacbon C_3-C_6 , heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C(=O)-NH_2$, $-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C(=O)-N(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C(=O)-OH$, $-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, aryl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -alkoxy, $-C_1-C_6$ -alkyl- C_1-C_6 -haloalkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-vòng cacbon C_3-C_6 , $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-aryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1-C_6$ -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- C_1-C_6 -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-O- $(C=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-N(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-OH$, $-C_1-C_6$ -alkyl- $C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-NH- $C(=NH)-NH_2$, $-S-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=S)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-S-C_1-C_6$ -alkyl, $-S-C(=O)-NH_2$, $-S-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-S-C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-S-C(=S)-NH_2$, $-S-C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-S-C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-O-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-S-C_1-C_6$ -alkyl, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=O)-NH(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=S)-NH_2$, $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl), $-C_1-C_6$ -alkyl-S- $C(=S)-NH(C_1-C_6$ -alkyl) $_2$, trong đó gốc R_4 , R_5 vòng có thể được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế R^x , trong đó ít nhất một trong số R^4 và R^5 là hydro, C_1-C_6 -alkyl hoặc vòng cacbon C_3-C_6 -, 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^x , trong đó R^x độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, nitro, hydroxyl, xyano, carboxyl, amino, sulfanyl, pentafluoro- λ^6 -sulfanyl, formyl, carbamoyl, carbamat, C_1-C_8 -alkyl, C_3-C_7 -xycloalkyl, C_1-C_8 -halogenoalkyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_3-C_7 -halogenoxycloalkyl có từ 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 từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1-C_8 -alkylsulfanyl, C_1-C_8 -halogenoalkylsulfanyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1-C_8 -alkylcarbonyl, C_1-C_8 -halogenoalkylcarbonyl có từ 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 từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C_1-C_8 -

alkylcarbonyloxy, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylcarbonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfanyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfinyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonyl có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen; C₁-C₈-alkylsulfonylamino, C₁-C₈-halogenoalkylsulfonylamino có từ 1 đến 5 nguyên tử halogen; sulfamoyl; C₁-C₈-alkylsulfamoyl và di-C₁-C₈-alkylsulfamoyl;

R⁶ và R⁷ độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-vòng cacbon; hoặc R⁶ và R⁷ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng cacbon C₃-C₆ hoặc dị vòng 3 đến 6 cạnh;

n là 0 hoặc 1;

W là oxy hoặc lưu huỳnh;

Y là NR⁸ với R⁸ là hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, hydroxy, C₁-C₆-alkoxy hoặc vòng cacbon C₃-C₆;

Z được chọn từ nhóm bao gồm xyano, -C(=O)-OR^a, -C(=O)-SR^a, -C(=O)-NR^bR^c, -C(=S)-NR^bR^c hoặc -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a, trong đó R^a được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-xycloalkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh và -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, hoặc R^a có thể cùng với R₄ và với các nguyên tử mà chúng gắn vào, tạo thành dị vòng 4 đến 7 cạnh, R^b và R^c độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, hydroxyl, C₁-C₆-alkoxy, xyano, C₁-C₆-xyanoalkyl, hoặc R^b có thể cùng với R⁴ và với các nguyên tử mà chúng gắn vào, tạo thành dị vòng 4 đến 7 cạnh, R^d và R^e độc lập được chọn từ nhóm bao gồm hydro, xyano, hydroxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-hydroxyalkyl, C₁-C₆-alkoxy, -O-C(=O)-C₁-C₆-alkyl, vòng cacbon C₃-C₆, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyl), -C(=O)-N(C₁-C₆-alkyl)₂, -C(=O)-OH, -C(=O)-O-C₁-C₆-alkyl, aryl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alkoxy, -C₁-C₆-alkyl- vòng cacbon C₃-C₆, -C₁-C₆-alkyl-aryl, -C₁-C₆-

alkyl-hydroxyaryl, -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-S-C₁-C₆-alkyl, -C₁-C₆-alkyl-S-C(=O)-C₁-C₆-alkyl, -C₁-C₆-alkyl-O-C(=O)-C₁-C₆-alkyl, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-NH(C₁-C₆-alkyl), -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-N(C₁-C₆-alkyl)₂, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-OH, -C₁-C₆-alkyl-C(=O)-O-C₁-C₆-alkyl, -C₁-C₆-alkyl-NH-C(=NH)-NH₂, trong đó ít nhất một trong số R^d và R^e là hydro, C₁-C₆-alkyl hoặc vòng cacbon C₃-C₆, hoặc R^d và R^e cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành carbonyl, vòng cacbon C₃-C₆, hoặc dị vòng 3 đến 6 cạnh;

miễn là 3,4,5-triclo-*N*-(2-xyanoetyl)-*N*-xyclohexylthiophen-2-carboxamit [24504-23-2], 3,4,5-triclo-*N,N*-bis(2-xyanoetyl)thiophen-2-carboxamit [24467-28-5], và 3,4,5-triclo-*N*-(2-xyanoetyl)-*N*-metylthiophen-2-carboxamit [24417-82-1] được loại trừ khỏi các hợp chất có công thức (I),

trong đó nếu W là oxy, và Y là NR⁸, với R⁸ là hydro hoặc C₁-C₆-alkyl, và n = 0, và R⁴ được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkyl-aryl, C₁-C₆-alkyl-hydroxyaryl, xyclopropyl và R⁵ là hydro hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành xyclopropyl, thì Z được chọn từ nhóm bao gồm xyano, -C(=O)-SR^a, -C(=O)-NR^bR^c, -C(=S)-NR^bR^c, -C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a.

để phòng trừ bệnh do vi khuẩn 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 nấm bệnh nấm mốc bột gây ra, như loài *Podosphaera* (ví dụ *Podosphaera leucotricha*), loài *Sphaerotheca* (ví dụ *Sphaerotheca fuliginea*); các bệnh do nấm bệnh rỉ sét gây ra, như loài *Uromyces* (ví dụ *Uromyces appendiculatus*); các bệnh do nấm 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 nấm 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)

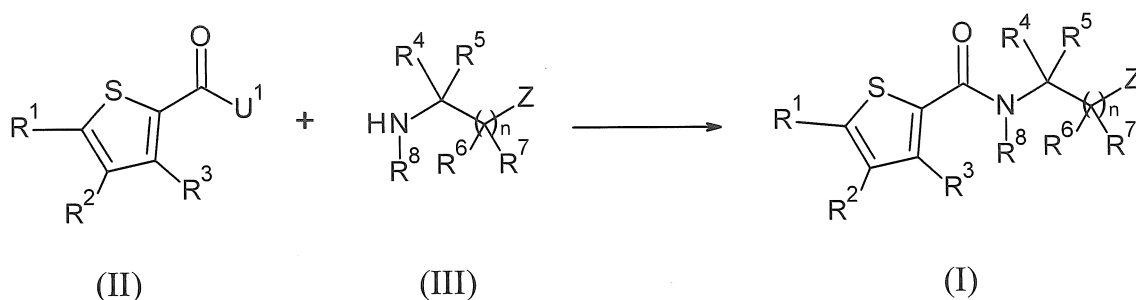
Sáng chế đề cập đến quy trình điều chế các hợp chất có công thức (I). Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng các con đường khác nhau tương tự với các quy trình đã biết (xem tài liệu tham khảo trong đó), và bằng một hoặc nhiều đường tổng hợp sau đây được mô tả dưới đây và trong phần thử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

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

Trừ khi được quy định khác, trong phần dưới đây, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , W, Y, Z và n có nghĩa giống như được nêu trên đây đối với các hợp chất có công thức (I).

Quy trình A1

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình A1 bao gồm bước cho hợp chất có công thức (II) hoặc một trong số các muối của nó phản ứng với hợp chất có công thức (III) hoặc một trong các muối của nó như được minh họa trên sơ đồ phản ứng sau:



Quy trình A1

trong đó U¹ là halogen, hydroxy hoặc nhóm C₁-C₆-alkoxy.

Khi U¹ là hydroxy, quy trình A1 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-oxid hexaflophosphat (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-yl)-1,1,3,3-tetrametylamin tetraflorurat (TBTU), (1-xyano-2-etoxy-2-oxoetylidenaminoxy)dimetylaminomorpholino-carbenium hexaflophosphat, N,N'-carbonyl-diimidazol, 2-etoxy-N-etoxy-carbonyl-1,2-dihydroquinolin (EEDQ), triphenylphosphin/tetraclorua-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-tripyrrolidinophosphoni hexaflophosphat (PyBroP), 2-clo-1,3-dimetylimidazolini clorua (DMC) và anhydrit propanphosphonic (T3P) và 3-(dietoxyphosphoryloxy)-1,2,3-benzotriazin-4(3H)-on (DEPBT).

Khi U¹ là halogen, quy trình A1 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 A1 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 trimetylamin, trietylamin, diisopropyletylamin, tributylamin, N,N-dimetylanilin, N-metylpiperidin, N,N-dimetylpyridin-4-amin, diazabixyclooctan (DABCO), diazabixyclo-nonen (DBN) hoặc diazabixycloundexen (DBU), hoặc các bazơ thơm như pyridin.

Khi U^1 là C_1 - C_6 -alkoxy, quy trình A1 có thể được thực hiện với lượng dư thành phần amin, tùy ý với sự có mặt của axit Lewis như nhôm trimetyl.

Nếu thích hợp, quy trình A1 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 A1 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 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-dimetylxetamit, 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 A1 có thể được thực hiện trong khí quyển trơ như khí quyển argon hoặc nitơ. Khi tiến hành quy trình A1, 1 mol hoặc lượng dư hợp chất có công thức (III) và từ 1 đến 5 mol bazơ có thể được sử dụng trên mỗi mol hợp chất có công thức (II). Cũng có thể sử dụng các thành phần phản ứng theo tỷ lệ khác. Việc làm sạch được thực hiện bằng các phương pháp đã biết.

Các hợp chất có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết rõ (J. Med. Chem. 2018, 61, 8670–8692; Tetrahedron,

44(1), 195-202; 1988, WO2009070485; WO2019086142; Chem. Res. Toxicol. 1990, 3, 118-124; JP49035334; JP49000223; Journal of Organic Chemistry (1989), 54(12), 2940-2949).

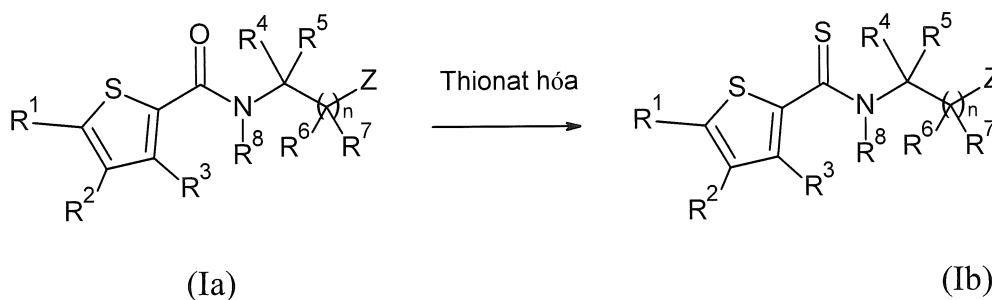
Các hợp chất có công thức (IIa) trong đó U^1 là hydroxy có bán trên thị trường, có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (IIb) trong đó U^1 là C_1 - C_6 -alkoxy bằng các quy trình đã biết rõ như thủy phân trong môi trường bazơ hoặc có thể được điều chế bằng các quy trình đã biết (*Beilstein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

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

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

Quy trình B1

Các hợp chất có công thức (Ib) có thể được điều chế bằng quy trình B1 từ hợp chất có công thức (Ia) bằng cách thực hiện phản ứng thionat hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:



Quy trình B1

Quy trình B1 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 B1 theo sáng chế có thể là lưu huỳnh (S), axit sulfhydric (H_2S), natri sulfua (Na_2S), natri hydrosulfua ($NaHS$), bo trisulfua (B_2S_3), bis(diethyl nhôm) sulfua ($(AlEt_2)_2S$), amoni sulfua ($(NH_4)_2S$), phosphor pentasulfua (P_2S_5), chất phản ứng Lawesson (2,4-bis(4-

metoxyphenyl)-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, kali cacbonat, kali 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-dimethylpyridin-4-amin hoặc N-metyl-piperidin.

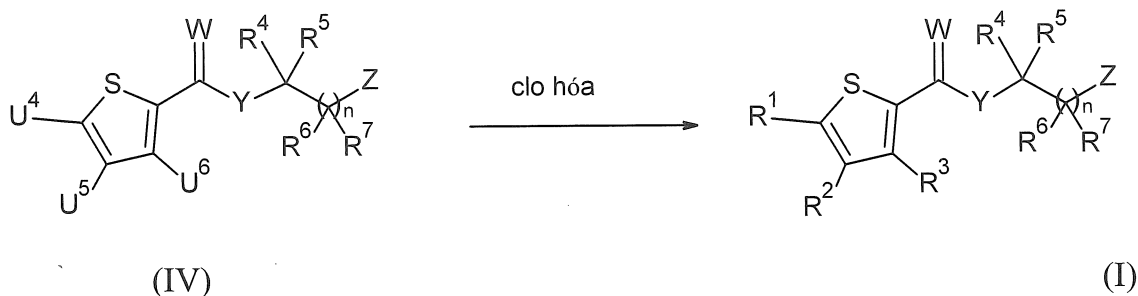
Các dung môi thích hợp để tiến hành quy trình B1 theo sáng chế là có thể là các dung môi hữu cơ trơ thông thường. Ưu tiên sử dụng các hydrocacbon béo, vòng béo, hoặc thơm tùy ý được halogen hóa, như ete dầu mỏ, hexan, heptan, xyclohexan, metylxyclohexan, benzen, toluen, xylen hoặc decalin, clobenzen, diclobenzen, diclometan, cloroform, cacbon tetraclohua, dicloetan hoặc tricloetan, các ete, như dietyl ete, diisopropyl ete, metyl *t*-butyl ete, metyl *t*-amyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan hoặc 1,2-dietoxyetan, 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 B1 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 (Ia).

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

Quy trình C1

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình C1 từ hợp chất có công thức (IV) hoặc một trong các muối của nó bằng cách thực hiện phản ứng clo hóa như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:



Quy trình C1

trong đó U^4 , U^5 và U^6 độc lập là hydro hoặc clo miễn là ít nhất một trong số U^4 , U^5 hoặc U^6 là hydro.

Quy trình C1 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (Angewandte Chemie, International Edition, 52(16), 4440-4444; 2013; ACS Catalysis, 6(11), 7839-7843; 2016; Journal of the American Chemical Society, 2017, 139, 888; Angewandte Chemie, International Edition, 2014, 53, 7928; Journal of the American Chemical Society, 2018, 140, 2789; WO2008156879; WO2012114285; WO2008109786; WO2007098356).

Quy trình C1 được thực hiện với sự có mặt của chất clo hóa và nếu thích hợp, với sự có mặt của dung môi.

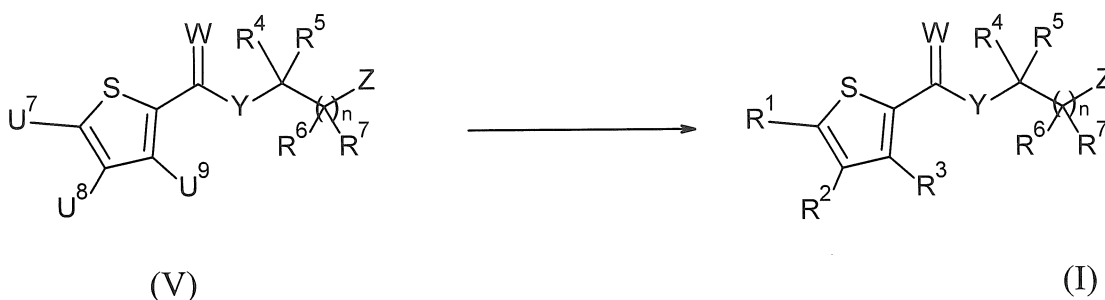
Các chất clo hóa thích hợp để thực hiện quy trình C1 không bị giới hạn cụ thể miễn là chúng được sử dụng để clo hóa. Các ví dụ về các chất clo hóa bao gồm N-closuxinimit, sulfuryl clorua, hexacloetan và 1,3-diclo-5,5-dimetyl-2,4-imidazolidindion.

Các dung môi thích hợp để thực hiện quy trình C1 không bị giới hạn cụ thể. Chúng có thể là dung môi hữu cơ trơ thông thường miễn là nó không hòa tan hợp chất để phản ứng với nó hoặc thể hiện tương tác cụ thể bất kỳ với nó. Các dung môi thích hợp có thể, chẳng hạn là các dung môi được mô tả đối với quy trình A1. Để thực hiện quy trình C1, cũng có thể có lợi khi sử dụng axit hữu cơ như axit axetic hoặc axit trifloaxetic làm dung môi hoặc đồng dung môi. Để thực hiện quy trình C1, cũng có thể có lợi khi sử dụng axit Lewis như kẽm clorua (II) làm chất xúc tác. Để thực hiện quy trình C1, cũng có thể có lợi khi sử dụng các chất xúc tác kim loại chuyển tiếp như chất xúc tác paladi. Để thực hiện quy trình C1, cũng có thể có lợi khi sử dụng chất phản ứng hữu cơ-kim loại thích hợp như n-butyllithi. Để thực hiện quy trình C1, theo quy

trình đã biết (WO2020079205), cũng có thể có lợi khi sử dụng bazơ thích hợp trước khi halogen hóa, như n-butyllithi, lithi di-isopropylamin, lithi tetrametylpiperidide, lithi bis(trimetylsilyl)amin, metyllithi hoặc clo-(2,2,6,6-tetrametyl-1-piperidyl)magie và các chất tương tự, tốt hơn là trong các điều kiện khan. Tùy ý, lithi clorua có thể được sử dụng trong hỗn hợp tiền chế với các chất phản ứng này.

Quy trình D1

Các hợp chất có công thức (I) như được xác định ở đây có thể được điều chế bằng quy trình D1 bao gồm bước tiến hành diazo hóa hợp chất có công thức (V) hoặc một trong các muối của nó sau đó là thể thơm để tạo ra hợp chất có công thức (I) như được minh họa trong sơ đồ phản ứng dưới đây:



Quy trình D1

trong đó U^7 , U^8 và U^9 độc lập là nhóm amino hoặc clo miễn là ít nhất một trong số U^7 , U^8 hoặc U^9 là nhóm amino.

Quy trình D1 có thể được thực hiện theo các quy trình đã biết (The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280 and 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 và các tài liệu tham khảo trong đó).

Các hợp chất có công thức (V) hoặc một trong các muối của nó như được định nghĩa ở đây có thể được điều chế bằng quy trình bao gồm bước khử nhóm nitro theo các phương pháp đã biết rõ (Science of Synthesis: Catalytic Reduction in Organic Synthesis 2; J. G. de Vries, 2018, chapter 2.7: Reduction of Nitro Compounds to Amines, Azo Compounds, Hydroxylamines, and Oximes, and Reduction of N-Oxides to Amines, và các tài liệu tham khảo trong đó) hoặc khử bảo vệ nhóm amino được bảo vệ theo các phương pháp đã biết rõ.

Ví dụ về các nhóm bảo vệ của nhóm amino bao gồm nhóm benzyl, nhóm 4-metoxybenzyl, nhóm alyl, nhóm C₁-C₆-alkylsulfonyl không được thế hoặc được thế, triflometylsulfonyl, phenylsulfonyl không được thế hoặc được thế, C₁-C₆-alkoxycarbonyl không được thế hoặc được thế, benzyloxycarbonyl không được thế hoặc được thế, alyloxycarbonyl, nhóm axetyl hoặc nhóm trifloaxetyl.

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

Các hợp chất có công thức (Ic) trong đó Z là -C(=O)-OR^a, trong đó R^a được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxycyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-xycloalkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh và -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (Id) trong đó Z là -C(=O)-OR^a, trong đó R^a là hydro và các rượu tương ứng hoặc một trong các muối của chúng bằng quy trình kết hợp đã biết được xử lý trong các điều kiện được mô tả liên quan đến quy trình A1.

Các hợp chất có công thức (Id) trong đó Z là -C(=O)-OR^a, trong đó R^a là hydro có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (Ic) trong đó Z là -C(=O)-OR^a, trong đó R^a được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-xyanoalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxycyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, -C₁-C₆-alkyl-Si(C₁-C₆-alkyl)₃, -C₁-C₆-alkyl-C₃-C₈-xycloalkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh và -C₁-C₆-alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh bằng các quy trình đã biết chẳng hạn 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.

Các hợp chất có công thức (Ie) trong đó Z là $-C(=O)-SR^a$, $-C(=O)-NR^bR^c$, $-C(=O)-NH-CR^dR^e-C(=O)-OR^a$ có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (Ic) trong đó Z là $-C(=O)-OR^a$, trong đó R^a là hydro và các thiol, amin tương ứng hoặc một trong các muối của chúng bằng các quy trình kết hợp đã biết trong các điều kiện như được mô tả liên quan đến quy trình A1.

Chế phẩm và chế phẩm phối chế

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

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

Chất mang là chất rắn hoặc 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, 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, dung môi hữu cơ và tổ hợp của chúng. Ví dụ về các dung môi thích hợp bao gồm các chất lỏng hóa học hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ nhóm gồm các hydrocacbon thơm và không thơm (như xyclohexan, parafin, alkylbenzen, xylen, toluen alkylnaphtalen, các hydrocacbon thơm được clo hóa hoặc béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua), các rượu và rượu đa chức (mà tùy ý cũng có thể được thế, este hóa và/hoặc este hóa, như butanol hoặc

glycol), các keton (như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon), các este (bao gồm chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin không được thế và được thế, các amit (như dimetylformamit), các lactam (như N-alkylpyrrolidon) và các lacton, sulfon và sulfoxit (như dimetyl sulfoxit). Chất mang cũng có thể là chất độn dạng khí hóa lỏng, tức là chất lỏng ở dạng khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và áp suất tiêu chuẩn, ví dụ các chất đẩy dạng sol khí như 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 metylxenluloza. 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 mà thường để phối chế các chế phẩm hóa nông bao gồm chất đẩy nước, chất hút ẩm, chất liên kết (chất kết dính, chất dính, tác nhân cố định, như carboxymetylxenluloza, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt

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

Việc chọn các chất phụ trợ liên quan đến phương thức áp dụng dự định hợp chất có công thức (I) và/hoặc liên quan đến các đặc tính vật lý của nó. 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 để 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 biến, 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 biến 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) cyproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamin, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfat, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) prothioconazol, (1.019) pyrisoxazol, (1.020) spiroxamin, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazol,

(1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.036) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-

dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) mefentrifluconazol, (1.056) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clorometyl)-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) ipfentrifluconazol, (1.082) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.083) 2-[6-(4-bromophenoxy)-2-(triflometyl)-3-pyridyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.084) 2-[6-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)-3-pyridyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.085) 3-[2-(1-cloxypropyl)-3-(3-clo-2-flo-phenyl)-2-hydroxypropyl]imidazol-4-carbonitril, (1.086) 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-diflophenyl)-1,1-diflo-2-hydroxy-3-(5-thioxo-4H-1,2,4-triazol-1-yl)propyl]-3-pyridyl]oxy]benzonitril, (1.087) N-isopropyl-N'-[5-metoxy-2-metyl-4-(2,2,2-triflo-1-hydroxy-1-phenyletyl)phenyl]-N-metylimidoformamit, (1.088) N'-{5-bromo-2-metyl-6-[(1-propoxypropan-2-yl)oxy]pyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.089) 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-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) isoflucypram, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-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-carbothioamid, (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 chuỗi hô hấp tại phức III, ví dụ (3.001) ametoctradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017) pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019) pyraoxystrobin, (3.020) trifloxystrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy)phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpen-3-enamit, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) fempicoxamid, (3.026) mandestrobin, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamid, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpen-3-enamit, (3.029) metyl {5-[3-(2,4-dimetylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-metylbenzyl}carbamit, (3.030) metyltetraprol, (3.031) florylpicoxamid.

4) Các chất ức chế nguyên phân và phân bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazol, (4.007) thiophanat-metyl, (4.008) zoxamid, (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) fluopimomid.

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) clorothalonil, (5.005) đồng hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxyclorea, (5.009) đồng(2+) sulfat, (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram kẽm, (5.017) đồng oxin, (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-dioxo-6,7-dihydro-5H-pyrol[3',4':5,6][1,4]dithiino[2,3-c][1,2]thiazol-3-cacbonitril.

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

7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.001) xyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin hydroclorua hydrat, (7.004) 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 chế 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-cloropyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.009) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.
- 10) Các chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclofos-metyl.
- 11) Các chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.001) tricyclazol, (11.002) 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) procymidon, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.
- 14) Các hợp chất có khả năng hoạt động dưới dạng chất phân tách, ví dụ (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.
- 15) Các chất diệt nấm khác được chọn từ nhóm gồm (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazol, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamide, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-calcium, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl 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) oxyfenthin, (15.024) pentaclorophenol và các muối, (15.025) axit phosphor và các muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetylát, (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)quinolin, (15.047) quinofumelin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng đồng phân hỗn hợp: 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)metylpyridin-2-yl}carbam, (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)metylpyridin-2-yl}carbam, (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-dimethylpyridin-3-yl)-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin), (15.068) (3-(4,4-diflo-5,5-dimethyl-4,5-dihydrothieno[2,3-c]pyridin-7-yl)quinolin), (15.069) (1-(4,5-dimethyl-1H-benzimidazol-1-yl)-4,4-diflo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin), (15.070) 8-flo-3-(5-flo-3,3-dimethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolon, (15.071) 8-flo-3-(5-flo-3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolon, (15.072) 3-(4,4-diflo-3,3-dimethyl-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}xyclopropanocarboxamid), (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]xyclopropanocarboxamid, (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]xyclopropanocarboxamid, (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]xyclopropanocarboxamid, (15.096) N,2-dimetoxi-N-[[4-[5-

(triflometyl}-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]propanamit, (15.097) N-etyl-2-metyl-N-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]propanamit, (15.098) 1-metoxo-3-metyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.099) 1,3-dimetoxo-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.100) 3-etyl-1-metoxo-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]ure, (15.101) 1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]piperidin-2-on, (15.102) 4,4-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isooxazolidin-3-on, (15.103) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isoxazolidin-3-on, (15.104) 3,3-dimetyl-1-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]piperidin-2-on, (15.105) 1-[[3-flo-4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]azepan-2-on, (15.106) 4,4-dimetyl-2-[[4-(5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isoxazolidin-3-on, (15.107) 5,5-dimetyl-2-[[4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl]metyl]isoxazolidin-3-on, (15.108) etyl 1-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}-1H-pyrazol-4-carboxylat, (15.109) N,N-dimetyl-1-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}-1H-1,2,4-triazol-3-amin, (15.110) N-{2,3-diflo-4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]benzyl}butanamit, (15.111) N-(1-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-metyl-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.115) 1-(5-(fluorometyl)-6-metyl-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.116) 1-(6-(diflometyl)-5-metoxo-pyridin-3-yl)-4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin, (15.117) 4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl dimetylcarbamit, (15.118) N-{4-[5-(triflometyl)-1,2,4-oxadiazol-3-yl]phenyl}propanamit, (15.119) 3-[2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-1,5-dihydro-2,4-benzodioxepin-6-yl metansulfonat, (15.120) 9-flo-3-[2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]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.001) + (1.001), (I.001) + (1.002), (I.001) + (1.003), (I.001) + (1.004), (I.001) + (1.005), (I.001) + (1.006), (I.001) + (1.007), (I.001) + (1.008), (I.001) + (1.009), (I.001) + (1.010), (I.001) + (1.011), (I.001) + (1.012), (I.001) + (1.013), (I.001) + (1.014), (I.001) + (1.015), (I.001) + (1.016), (I.001) + (1.017), (I.001) + (1.018), (I.001) + (1.019), (I.001) + (1.020), (I.001) + (1.021), (I.001) + (1.022), (I.001) + (1.023), (I.001) + (1.024), (I.001) + (1.025), (I.001) + (1.026), (I.001) + (1.027), (I.001) + (1.028), (I.001) + (1.029), (I.001) + (1.030), (I.001) + (1.031), (I.001) + (1.032), (I.001) + (1.033), (I.001) + (1.034), (I.001) + (1.035), (I.001) + (1.036), (I.001) + (1.037), (I.001) + (1.038), (I.001) + (1.039), (I.001) + (1.040), (I.001) + (1.041), (I.001) + (1.042), (I.001) + (1.043), (I.001) + (1.044), (I.001) + (1.045), (I.001) + (1.046), (I.001) + (1.047), (I.001) + (1.048), (I.001) + (1.049), (I.001) + (1.050), (I.001) + (1.051), (I.001) + (1.052), (I.001) + (1.053), (I.001) + (1.054), (I.001) + (1.055), (I.001) + (1.056), (I.001) + (1.057), (I.001) + (1.058), (I.001) + (1.059), (I.001) + (1.060), (I.001) + (1.061), (I.001) + (1.062), (I.001) + (1.063), (I.001) + (1.064), (I.001) + (1.065), (I.001) + (1.066), (I.001) + (1.067), (I.001) + (1.068), (I.001) + (1.069), (I.001) + (1.070), (I.001) + (1.071), (I.001) + (1.072), (I.001) + (1.073), (I.001) + (1.074), (I.001) + (1.075), (I.001) + (1.076), (I.001) + (1.077), (I.001) + (1.078), (I.001) + (1.079), (I.001) + (1.080), (I.001) + (1.081), (I.001) + (1.082), (I.001) + (1.083), (I.001) + (1.084), (I.001) + (1.085), (I.001) + (1.086), (I.001) + (1.087), (I.001) + (1.088), (I.001) + (1.089), (I.001) + (2.001),

(I.001) + (2.002), (I.001) + (2.003), (I.001) + (2.004), (I.001) + (2.005), (I.001) +
 (2.006), (I.001) + (2.007), (I.001) + (2.008), (I.001) + (2.009), (I.001) + (2.010),
 (I.001) + (2.011), (I.001) + (2.012), (I.001) + (2.013), (I.001) + (2.014), (I.001) +
 (2.015), (I.001) + (2.016), (I.001) + (2.017), (I.001) + (2.018), (I.001) + (2.019),
 (I.001) + (2.020), (I.001) + (2.021), (I.001) + (2.022), (I.001) + (2.023), (I.001) +
 (2.024), (I.001) + (2.025), (I.001) + (2.026), (I.001) + (2.027), (I.001) + (2.028),
 (I.001) + (2.029), (I.001) + (2.030), (I.001) + (2.031), (I.001) + (2.032), (I.001) +
 (2.033), (I.001) + (2.034), (I.001) + (2.035), (I.001) + (2.036), (I.001) + (2.037),
 (I.001) + (2.038), (I.001) + (2.039), (I.001) + (2.040), (I.001) + (2.041), (I.001) +
 (2.042), (I.001) + (2.043), (I.001) + (2.044), (I.001) + (2.045), (I.001) + (2.046),
 (I.001) + (2.047), (I.001) + (2.048), (I.001) + (2.049), (I.001) + (2.050), (I.001) +
 (2.051), (I.001) + (2.052), (I.001) + (2.053), (I.001) + (2.054), (I.001) + (2.055),
 (I.001) + (2.056), (I.001) + (2.057), (I.001) + (2.058), (I.001) + (2.059), (I.001) +
 (2.060), (I.001) + (3.001), (I.001) + (3.002), (I.001) + (3.003), (I.001) + (3.004),
 (I.001) + (3.005), (I.001) + (3.006), (I.001) + (3.007), (I.001) + (3.008), (I.001) +
 (3.009), (I.001) + (3.010), (I.001) + (3.011), (I.001) + (3.012), (I.001) + (3.013),
 (I.001) + (3.014), (I.001) + (3.015), (I.001) + (3.016), (I.001) + (3.017), (I.001) +
 (3.018), (I.001) + (3.019), (I.001) + (3.020), (I.001) + (3.021), (I.001) + (3.022),
 (I.001) + (3.023), (I.001) + (3.024), (I.001) + (3.025), (I.001) + (3.026), (I.001) +
 (3.027), (I.001) + (3.028), (I.001) + (3.029), (I.001) + (3.030), (I.001) + (3.031),
 (I.001) + (4.001), (I.001) + (4.002), (I.001) + (4.003), (I.001) + (4.004), (I.001) +
 (4.005), (I.001) + (4.006), (I.001) + (4.007), (I.001) + (4.008), (I.001) + (4.009),
 (I.001) + (4.010), (I.001) + (4.011), (I.001) + (4.012), (I.001) + (4.013), (I.001) +
 (4.014), (I.001) + (4.015), (I.001) + (4.016), (I.001) + (4.017), (I.001) + (4.018),
 (I.001) + (4.019), (I.001) + (4.020), (I.001) + (4.021), (I.001) + (4.022), (I.001) +
 (4.023), (I.001) + (4.024), (I.001) + (4.025), (I.001) + (4.026), (I.001) + (5.001),
 (I.001) + (5.002), (I.001) + (5.003), (I.001) + (5.004), (I.001) + (5.005), (I.001) +
 (5.006), (I.001) + (5.007), (I.001) + (5.008), (I.001) + (5.009), (I.001) + (5.010),
 (I.001) + (5.011), (I.001) + (5.012), (I.001) + (5.013), (I.001) + (5.014), (I.001) +
 (5.015), (I.001) + (5.016), (I.001) + (5.017), (I.001) + (5.018), (I.001) + (5.019),
 (I.001) + (5.020), (I.001) + (5.021), (I.001) + (5.022), (I.001) + (5.023), (I.001) +
 (6.001), (I.001) + (6.002), (I.001) + (6.003), (I.001) + (6.004), (I.001) + (7.001),

(I.001) + (7.002), (I.001) + (7.003), (I.001) + (7.004), (I.001) + (7.005), (I.001) + (7.006), (I.001) + (8.001), (I.001) + (9.001), (I.001) + (9.002), (I.001) + (9.003), (I.001) + (9.004), (I.001) + (9.005), (I.001) + (9.006), (I.001) + (9.007), (I.001) + (9.008), (I.001) + (9.009), (I.001) + (10.001), (I.001) + (10.002), (I.001) + (10.003), (I.001) + (11.001), (I.001) + (11.002), (I.001) + (12.001), (I.001) + (12.002), (I.001) + (12.003), (I.001) + (12.004), (I.001) + (13.001), (I.001) + (13.002), (I.001) + (13.003), (I.001) + (13.004), (I.001) + (13.005), (I.001) + (13.006), (I.001) + (14.001), (I.001) + (14.002), (I.001) + (15.001), (I.001) + (15.002), (I.001) + (15.003), (I.001) + (15.004), (I.001) + (15.005), (I.001) + (15.006), (I.001) + (15.007), (I.001) + (15.008), (I.001) + (15.009), (I.001) + (15.010), (I.001) + (15.011), (I.001) + (15.012), (I.001) + (15.013), (I.001) + (15.014), (I.001) + (15.015), (I.001) + (15.016), (I.001) + (15.017), (I.001) + (15.018), (I.001) + (15.019), (I.001) + (15.020), (I.001) + (15.021), (I.001) + (15.022), (I.001) + (15.023), (I.001) + (15.024), (I.001) + (15.025), (I.001) + (15.026), (I.001) + (15.027), (I.001) + (15.028), (I.001) + (15.029), (I.001) + (15.030), (I.001) + (15.031), (I.001) + (15.032), (I.001) + (15.033), (I.001) + (15.034), (I.001) + (15.035), (I.001) + (15.036), (I.001) + (15.037), (I.001) + (15.038), (I.001) + (15.039), (I.001) + (15.040), (I.001) + (15.041), (I.001) + (15.042), (I.001) + (15.043), (I.001) + (15.044), (I.001) + (15.045), (I.001) + (15.046), (I.001) + (15.047), (I.001) + (15.048), (I.001) + (15.049), (I.001) + (15.050), (I.001) + (15.051), (I.001) + (15.052), (I.001) + (15.053), (I.001) + (15.054), (I.001) + (15.055), (I.001) + (15.056), (I.001) + (15.057), (I.001) + (15.058), (I.001) + (15.059), (I.001) + (15.060), (I.001) + (15.061), (I.001) + (15.062), (I.001) + (15.063), (I.001) + (15.064), (I.001) + (15.065), (I.001) + 15.066, (I.001) + (15.067), (I.001) + (15.068), (I.001) + (15.069), (I.001) + (15.070), (I.001) + (15.071), (I.001) + (15.072), (I.001) + (15.073), (I.001) + (15.074), (I.001) + (15.075), (I.001) + (15.076), (I.001), (I.001) + (15.077), (I.001) + (15.078), (I.001) + (15.079), (I.001) + (15.080), (I.001) + (15.081), (I.001) + (15.082), (I.001) + (15.083), (I.001) + (15.084), (I.001) + (15.085), (I.001) + (15.086), (I.001) + (15.087), (I.001) + (15.088), (I.001) + (15.089), (I.001) + (15.090), (I.001) + (15.091), (I.001) + (15.092), (I.001) + (15.093), (I.001) + (15.094), (I.001) + (15.095), (I.001) + (15.096), (I.001) + (15.097), (I.001) + (15.098), (I.001) + (15.099), (I.001) + (15.100), (I.001) + (15.101), (I.001) + (15.102), (I.001) + (15.103), (I.001) + (15.104), (I.001) + (15.105), (I.001) + (15.106), (I.001) + (15.107), (I.001) + (15.108), (I.001) + (15.109), (I.001) + (15.110), (I.001) + (15.111),

(I.001) + (15.112), (I.001) + (15.113), (I.001) + (15.114), (I.001) + (15.115), (I.001) + (15.116), (I.001) + (15.117), (I.001) + (15.118), (I.001) + (15.119), (I.001) + (15.120), (I.001) + (15.121), (I.001) + (15.122), (I.001) + (15.123), (I.001) + (15.124), (I.001) + (15.125), (I.001) + (15.126), (I.001) + (15.127).

Trong các tổ hợp này, thành phần thứ nhất là hợp chất có công thức (I) như được xác định trong bảng 1a và 1b (ví dụ I.001) và thành phần thứ hai là chất diệt nấm được chọn trong các nhóm từ 1 đến 15 như được xác định trong bản mô tả này. Ví dụ, tổ hợp (I.001) + (1.001) tương ứng với tổ hợp bao gồm hợp chất I.001 trong các bảng 1a và 1b và xyproconazol (1.001).

Theo một số phương án khác, các tổ hợp hợp chất tương ứng với các tổ hợp được mô tả ở trên trong đó hợp chất (I.001) được thay thế bằng hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất được nêu trong các bảng 1a và 1b.

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

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

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

North Carolina là chất diệt nấm TAEGRO® hoặc TAEGRO® ECO (đăng ký EPA số 70127-5); (B1.10) *Bacillus mycoides*, thể phân lập J (có sẵn ở dạng BmJ TGAi hoặc WG từ Certis USA); (B1.11) *Bacillus licheniformis*, đặc biệt là chủng SB3086 (có sẵn ở dạng EcoGuard TM Biofungicide và Green Releaf từ Novozymes); (B1.12) chủng *Paenibacillus* sp. có mã truy cập là NRRL B-50972 hoặc mã truy cập là NRRL B-67129 và được mô tả trong công bố patent quốc tế số WO 2016/154297.

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*, đặc biệt là chủng CON/M/91-8 (mã truy cập số DSM-9660; ví dụ, Contans ® từ Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, đặc biệt là chủng NRRL Y-30752 (ví dụ, Shemer®); (B2.3) *Microsphaeropsis ochracea* (ví dụ, Microx® từ Prophyta); (B2.5) *Trichoderma* spp., bao gồm *Trichoderma atroviride*, chủng SC1 được mô tả trong đơn đăng ký quốc tế số PCT/IT2008/000196); (B2.6) *Trichoderma harzianum* rifai chủng KRL-AG2 (cũng

được biết là chủng T-22, /ATCC 208479, ví dụ, PLANTSHIELD T-22G, Rootshield®, và TurfShield từ BioWorks, US); (B2.14) *Gliocladium roseum*, chủng 321U từ W.F. Stoneman Company LLC; (B2.35) *Talaromyces flavus*, chủng V117b; (B2.36) *Trichoderma asperellum*, chủng ICC 012 từ Isagro; (B2.37) *Trichoderma asperellum*, chủng SKT-1 (ví dụ, ECO-HOPE® từ Kumiai Chemical Industry); (B2.38) *Trichoderma atroviride*, chủng CNCM I-1237 (ví dụ, Esquive® WP từ Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, chủng số V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, chủng NMI số V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, chủng LC52 (ví dụ, Tenet bởi Agrimm Technologies Limited); (B2.44) *Trichoderma atroviride*, chủng ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) *Trichoderma atroviride*, chủng T11 (IMI352941/ CECT20498); (B2.46) *Trichoderma harmatum*; (B2.47) *Trichoderma harzianum*; (B2.48) *Trichoderma harzianum rifai* T39 (ví dụ, Trichodex® từ Makhteshim, US); (B2.49) *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là chủng KD (ví dụ, Trichoplus từ Biological Control Products, SA (thu được bởi Becker Underwood)); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, chủng ITEM 908 (ví dụ, Trianum-P từ Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, chủng TH35 (ví dụ, Root-Pro từ Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (cũng được biết là *Gliocladium virens*), đặc biệt là chủng GL-21 (ví dụ, SoilGard 12G từ Certis, US); (B2.53) *Trichoderma viride*, chủng TV1 (ví dụ, Trianum-P từ Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, đặc biệt là chủng AQ 10 (ví dụ, AQ 10® bởi IntrachemBio Italia); (B2.56) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là các bào tử chồi của chủng DSM14940; (B2.57) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là các bào tử chồi của chủng DSM 14941; (B2.58) *Aureobasidium pullulans*, đặc biệt là hỗn hợp của các bào tử chồi của các chủng DSM14940 và DSM 14941 (ví dụ, Botector® của bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, chủng H39 (của Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (Synonym: *Clonostachys rosea f. catenulate*) chủng J1446 (ví dụ, Prestop ® của AgBio Inc. và ví dụ, Primastop® của Kemira Agro Oy); (B2.70) *Lecanicillium lecanii* (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*) conidia của chủng KV01 (ví dụ, Vertalec® của Koppert/Arysta); (B2.71) *Penicillium vermiculatum*; (B2.72) *Pichia anomala*, chủng WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75) *Trichoderma atroviride*, chủng SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76)

Trichoderma atroviride, chủng SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77) *Trichoderma atroviride*, chủng SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78) *Trichoderma gamsii* (trước đây là *T. viride*), chủng ICC080 (IMI CC 392151 CABI, ví dụ, BioDerma của AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, chủng DB 103 (ví dụ, T-Gro 7456 của Dagut Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, chủng IMI 206039 (ví dụ, Binab TF WP của BINAB Bio-Innovation AB, Sweden); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (ví dụ, Tricovab của Ceplac, Brazil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, đặc biệt là chủng HRU3 (ví dụ, Botry-Zen® của Botry-Zen Ltd, NZ); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (trước đây là *V. dahliae*), chủng WCS850 (CBS 276.92; ví dụ, Dutch Trig của Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) hỗn hợp của *Trichoderma asperellum* chủng ICC 012 và *Trichoderma gamsii* chủng ICC 080 (sản phẩm được biết là ví dụ, BIO-TAM™ từ Bayer CropScience LP, US).

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

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

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

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

Vi khuẩn và nấm mà có thể được bổ sung làm 'thành phần cây' 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, "Requiem™ 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, benfurcarb, 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 axephat, azamethiphos, azinphos-etyl, azinphos-metyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-methyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoate, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon và vamidothion.

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

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

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

- (5) Các chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nAChR), ví dụ các spinosyn, ví dụ spinetoram và spinosad.
- (6) Các chất điều biến dị lập thể kênh clorua qua cổng glutamat (Glutamate-gated chloride channel - GluCl), ví dụ như các avermectin/milbemycin, chẳng hạn abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.
- (7) Các chất giả hormon ấu trùng, ví dụ như, chất tương tự hormon ấu trùng, ví dụ, hydropren, kinopren và methopren hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.
- (8) Các chất ức chế không đặc hiệu (nhiều vị trí) hỗn hợp, ví dụ như các alkyl halogenua, chẳng hạn, metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc cloropicrine hoặc sulfuric acid 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 etoxazol.
- (11) Các 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 azoxyclofen, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargit hoặc tetradifon.
- (13) Các chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách làm gián đoạn gradien proton, ví dụ như chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.
- (14) Các chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinic, ví dụ như bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.
- (15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 0, ví dụ như bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclofenuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.

- (16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 1, ví dụ buprofezin.
- (17) Chất phá vỡ quá trình lột xác (cụ thể là đối với Diptera, tức là, côn trùng hai cánh), ví dụ như cyromazine.
- (18) Các chất chủ vận thụ thể ecdyson, ví dụ như chromafenozide, halofenozide, metoxyfenozide và tebufenozide.
- (19) Các chất chủ vận thụ thể octopamin, ví dụ như amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể, ví dụ như hydrametylnon hoặc 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 metaflumizon.
- (23) Các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, ví dụ như các dẫn xuất axit tetronic và tetramic, ví dụ, spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.
- (24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức IV ty thể, ví dụ như các phosphin, 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 pyflubumid.
- (28) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức II ty thể, ví dụ như các dẫn xuất beta-ketonitril, ví dụ, xyenopyrafen và xyflumetofen và carboxanilit, ví dụ như pyflubumit.
- các hoạt chất khác, ví dụ như Afidopyropen, Afoxolaner, Azadirachtin, Benclothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Broflanilide, Bromopropylate, Chinomethionat, Cloroprallethrin, 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 (được biết từ WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (được biết từ WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (được biết từ WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (được biết từ WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl etyl cacbonat (được biết từ EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl-piperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (được biết từ WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (được biết từ JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (được biết từ WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflo-propan-2-on (được biết từ WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoyl)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafloretyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (được biết từ CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)-benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(trans-1-oxido-3-thietanyl)-benzamit và 4-[(5S)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit (được biết từ WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit, (+)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit và (-)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]-propanamit

(được biết từ WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[*(2E)*-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-carbonitril (được biết từ CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-*N*-[4-clo-2-metyl-6-[(metylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit, (Liudaibenjiaxuanan, được biết từ CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); *N*-[4-clo-2-[[*(1,1*-dimetyletyl)amino]carbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1*H*-Pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), *N*-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-diclo-4-[(3,3-diclo-2-propen-1-yl)oxy]phenoxy]propoxy]-2-metoxi-6-(triflometyl)-pyrimidin (được biết từ CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (*2E*)- và 2(*Z*)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-*N*-[4-(diflometoxy)phenyl]-hydrakēmarboxamit (được biết từ CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); este của axit 3-(2,2-dicloetenyl)-2,2-dimetyl-4-(1*H*-benzimidazol-2-yl)phenyl-xyclopropanocarboxylic (được biết từ CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4*aS*)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[*(metoxycarbonyl)*4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]carbonyl]-indeno[1,2-*e*][1,3,4]oxadiazin-4*a*(3*H*)-carboxylic (được biết từ CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-*O*-etyl-2,4-di-*O*-metyl-, 1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoetoxy)phenyl]-1*H*-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]-α-*L*-mannopyranoza (được biết từ US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-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-trifluorometyl-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 (được biết từ WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), *N*-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]-*N*-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]-propanamit (được biết từ WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và *N*-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(metylamino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit (được biết từ CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)

-4-[[4-(triflometyl)phenyl]metoxy]-pyrimidin (được biết từ WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1-metyl-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (được biết từ WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-1,8-diazaspiro[4.5]decan-2,4-dion (được biết từ WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etyl este của axit 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-carbonic (được biết từ WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit (được biết từ DE 3639877 A1, WO 2012/029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(E)]-N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit, (được biết từ WO 2016/005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(Z)]-N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinyliden]-2,2,2-triflo-axetamit, (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-propoxy-4-(trifluorometyl)phenoxy]-9-[[5-(triflometyl)-2-pyridinyl]oxy]-9-azabicyclo[3.3.1]nonan (được biết từ 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, fenchlorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphthalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoyl)amino]phenyl}sulfonyl)benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

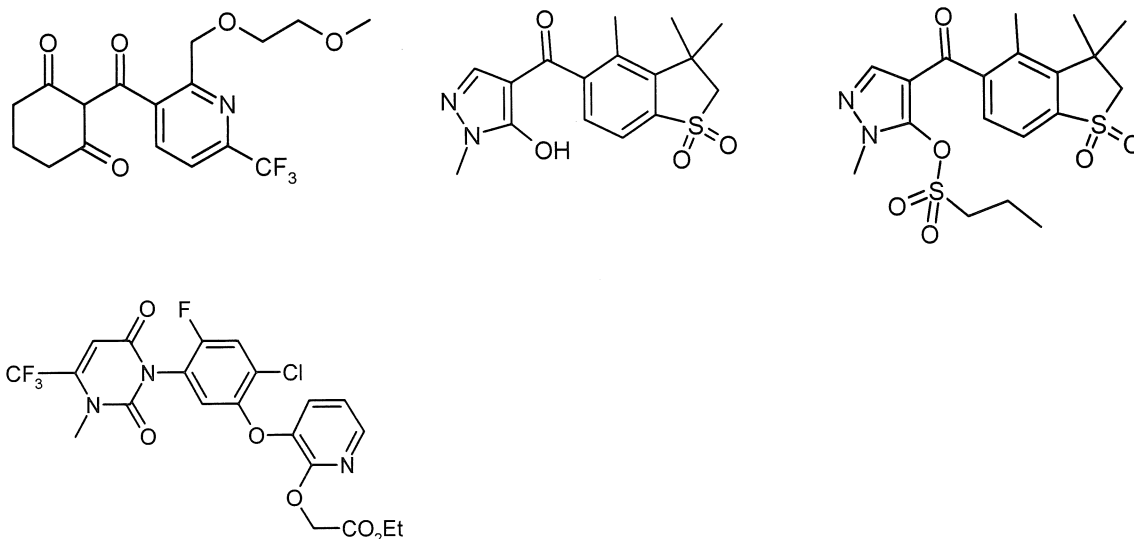
Ví dụ về các tác nhân diệt cỏ mà có thể được trộn với các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng là:

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, ammoniumsulfamate, 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-butyrate, -kali, -heptanoate, và -octanoate, 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, clorophthalim, clorotoluron, chlorthal-dimetyl, chlorsulfuron, 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, -dimetylamoni, -diolamin, -etyl, -2-ethylhexyl, -isobutyl, -isooctyl, -isopropylamoni, -kali, -triisopropanolamoni, và -trolamin, 2,4-DB, 2,4-DB-butyl, -dimetylammonium, -isooctyl, -kali, và -natri, daimuron (dymron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosyl-pyrazolate (DTP), dicamba, dichlobenil, 2-(2,4-diclobenzyl)-4,4-dimetyl-1,2-oxazolidin-3-on, 2-(2,5-diclobenzyl)-4,4-dimetyl-1,2-oxazolidin-3-on, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclofop-metyl, diclofop-P-metyl, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopyr, diflufenzopyr-natri, dimefuron, dimepiperate, dimethachlor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramin, 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}etansulfonamide, 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, fenquinotriene, fentrazamide, flamprop, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flazasulfuron, 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, -dimetylamoni và -metyl, fluoroglycofen, fluoroglycofen-etyl,

flupropanate, flupyrsulfuron, flupyrsulfuron-metyl-natri, fluridone, flurochloridone, fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl, flurtamone, fluthiacet, fluthiacet-metyl, fomesafen, fomesafen-natri, foramsulfuron, fosamin, glufosinate, glufosinate-amoni, glufosinat-P-natri, glufosinate-P-amoni, glufosinate-P-natri, glyphosat, glyphosate-amoni, -isopropylamoni, -diamoni, -dimetylamoni, -kali, -natri, và -trimesium, H-9201, tức là O-(2,4-dimetyl-6-nitrophenyl) O-etyl isopropylphosphoramidothioate, 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-(dimetoxylphosphoryl) etyl-(2,4-diclorophenoxy)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-octanoate, -kali và -natri, ipfencarbazone, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutole, karbutilate, KUH-043, i.e. 3-([5-(diflometyl)-1-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-yl]metyl)sulfonyl)-5,5-dimetyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, -isopropylamoni, -kali, và -natri, MCPB, MCPB-metyl, -etyl và -natri, mecoprop, mecoprop-natri, và -butotyl, mecoprop-P, mecoprop-P-butotyl, -dimetylamoni, -2-etylhexyl, và -kali, mefenacet, mefluidide, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrione, methabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, metazachlor, metazosulfuron, methabenzthiazuron, methiopyrsulfuron, methiozolin, metyl isothioxyanat, metobromuron, metolachlor, S-metolachlor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metyl, molinat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-este, MT-5950, tức là N-(3-clo-4-isopropylphenyl)-2-metyl-pentan amit, NGGC-011, napropamide, NC-310, tức là [5-(benzyloxy)-1-metyl-1H-pyrazol-4-yl](2,4-diclorophenyl)methanone, neburon, nicosulfuron, axit nonanoic (axit pelargonic), norflurazon, axit oleic (axit béo), orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paraquat, paraquat diclorua, pebulate, pendimethalin, penoxsulam, pentachlorophenol, pentoxazone, pethoxamid, dầu mỏ, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilachlor, primisulfuron, primisulfuron-metyl, prodiamin, profoxydim, prometon, prometryn, propachlor,

propanil, propaquizafof, 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, pyrihiobac, pyrihiobac-natri, pyroxasulfone, pyroxulam, quinclorac, quinmerac, quinclamin, 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-(trifluorometyl)phenoxy]-2-nitrobenzoate, 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, tepraloxymid, 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, urea sulfate, 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 đây:



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

Acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, axit 5-aminolevulinic, ancymidol, 6-benzylaminopurine, Brassinolid, catechin, chlormequat clorua, cloprop, xyclanilid, axit 3-(xycloprop-1-enyl) propionic, daminozid, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-natri, endothal, endothal-dikali, -dinatri, và -mono(N,N-dimetylalkylamoni), ethephon, flumetralin, flurenol, flurenol-butyl, flurprimidol, forchlorfenuron, axit gibberellic, inabenfide, axit indol-3-axetic (IAA), axit 4-indol-3-ylbutyric, isoprothiolane, probenazol, axit jasmonic, maleic hydrazit, mepiquat clorua, 1-metylxyclopropene, metyl jasmonate, 2-(1-naphtyl)axetamit, axit 1-naphtylaxetic, axit 2-naphtyloxyaxetic, hỗn hợp nitrophenolat, paclobutrazol, N-(2-phenyletyl)-beta-alanin, axit N-phenylphthalamic, prohexadione, prohexadione-canxi, prohydrojasmon, axit salixylic, strigolactone, tecnazene, thidiazuron, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etyl, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

Các phương pháp và sử dụng

Các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa 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 trên thực vật này là nguyên nhân của rất nhiều bệnh ở thực vật.

Cụ thể hơn, các hợp chất có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa chúng có thể được sử dụng làm chất diệt nấm. Đối với mục đích của bản mô tả, thuật ngữ “chất diệt nấm” 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 mỏ 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 ươm), *Rubiaceae sp.* (ví dụ, cà phê), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (ví dụ, chanh, cam và bưởi); *Solanaceae sp.* (ví dụ, cà chua), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (ví dụ, rau diếp), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (ví dụ, dưa chuột), *Alliaceae sp.* (ví dụ, tỏi tây, hành), *Papilionaceae sp.* (ví dụ, đậu Hà Lan); các 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 tặc, 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 để 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 kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng cũng được xử lý bằng các phương pháp theo sáng chế. Tốt hơn, nếu các cây thuộc cây trồng 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 chúng truyền các tính trạng hữu dụng, đặc biệt có lợi cho các thực vật này (bất luận thu được bằng phương pháp chọn giống và/hoặc phương pháp công nghệ sinh học hay không).

Thực vật và giống thực vật mà có thể được xử lý bằng phương pháp được mô tả trên đây bao gồm thực vật và giống thực vật kháng lại một hoặc nhiều điều kiện bất lợi sinh học, tức là, thực vật này thể hiện khả năng phòng vệ tốt hơn chống lại động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại giun tròn, côn trùng, ve bét, nấm gây bệnh cho thực vật, vi khuẩn, virus và/hoặc viroít.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Mầm bệnh và bệnh

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

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 *Cycloconium* (ví dụ *Cycloconium oleaginum*), loài *Diaporthe* (ví dụ *Diaporthe citri*), loài *Elsinoe* (ví dụ *Elsinoe fawcettii*), loài *Gloeosporium* (ví dụ *Gloeosporium laeticolor*), loài *Glomerella* (ví dụ *Glomerella cingulate*), loài *Guignardia* (ví dụ *Guignardia bidwelli*), loài *Leptosphaeria* (ví dụ *Leptosphaeria maculans*), loài *Magnaporthe* (ví dụ *Magnaporthe grisea*), loài *Microdochium* (ví dụ *Microdochium nivale*), loài *Mycosphaerella* (ví dụ *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella* hoặc *Mycosphaerella fijiensis*), loài *Phaeosphaeria* (ví dụ *Phaeosphaeria nodorum*), loài *Pyrenophora* (ví dụ *Pyrenophora teres* hoặc *Pyrenophora tritici repentis*), loài *Ramularia* (ví dụ *Ramularia collo-cygni* hoặc *Ramularia areola*), loài *Rhynchosporium* (ví dụ *Rhynchosporium secalis*), loài *Septoria* (ví dụ *Septoria apii* hoặc *Septoria lycopersici*), loài *Stagonospora* (ví dụ *Stagonospora nodorum*), loài *Typhula* (ví dụ *Typhula incarnate*), loài *Venturia* (ví dụ *Venturia inaequalis*),

các bệnh ở rễ và thân do, ví dụ, loài *Corticium* (ví dụ *Corticium 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 bắp ngô và chùy (bao gồm lõi ngô) do, ví dụ, loài *Alternaria*, (ví dụ *Alternaria spp.*), loài *Aspergillus* (ví dụ *Aspergillus flavus*), loài *Cladosporium* (ví dụ *Cladosporium cladosporioides*, loài *Claviceps* (ví dụ *Claviceps purpurea*), loài

Fusarium, (ví dụ *Fusarium culmorum*), loài *Gibberella* (ví dụ *Gibberella zeae*), loài *Monographella*, (ví dụ *Monographella nivalis*), loài *Stagnospora*, (ví dụ *Stagnospora nodorum*) gây ra;

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

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

các bệnh thối và héo từ hạt và từ đất, và cả các bệnh ở cây non do, ví dụ, loài *Alternaria* (ví dụ *Alternaria brassicicola*), loài *Aphanomyces* (ví dụ *Aphanomyces euteiches*), *Ascochyta* (ví dụ *Ascochyta lentis*), loài *Aspergillus* (ví dụ *Aspergillus flavus*), loài *Cladosporium* (ví dụ *Cladosporium herbarum*), loài *Cochliobolus* (ví dụ *Cochliobolus sativus* (dạng bào tử: *Drechslera*, *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* (ví dụ *Rhizopus oryzae*), loài *Sclerotium* (ví dụ *Sclerotium rolfsii*), loài *Septoria* (ví dụ *Septoria nodorum*), loài *Typhula* (ví dụ *Typhula incarnate*), loài *Verticillium* (ví dụ *Verticillium dahlia*) gây ra;

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

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

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

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

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

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

Các bệnh do mầm bệnh vi khuẩn, ví dụ loài *Xanthomonas* (ví dụ *Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*), loài *Pseudomonas* (ví dụ *Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*), loài *Erwinia* (ví dụ *Erwinia amylovora*) gây ra.

Xử lý hạt

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

Thuật ngữ “(các) hạt” như được sử dụng trong bản mô tả bao gồm hạt ở trạng thái ngủ, hạt đã 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 cả cả thực vật nảy mầm, cây non đã nhú lên và thực vật sau khi nhú.

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

Khi 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. Phần lớn thương tổn đối với cây trồng do sinh vật có hại gây ra đều bắt nguồn từ sự nhiễm khuẩn của hạt trước khi gieo hoặc sau khi cây nảy mầm. Pha này đặc biệt quan trọng vì rễ và chồi của thực vật đang phát triển đặc biệt nhạy cảm, và ngay cả thương tổn nhỏ cũng có thể gây chết cây.

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

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

Như đã chỉ ra trên đây, các hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng, nguyên như vậy, trực tiếp lên hạt, tức là không sử dụng thành phần bất kỳ khác và không pha loãng, hoặc chế phẩm chứa các hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng. Tốt hơn là các chế phẩm được áp dụng lên hạt ở dạng bất kỳ thích hợp. Ví dụ về các chế phẩm phối chế 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 phối chế này là các chế phẩm phối chế dùng ngay hoặc có thể là các thể đặc cần được pha loãng trước khi sử dụng.

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

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

Các thuốc nhuộm hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các thuốc nhuộm mà thường dùng cho mục đích như vậy. Có thể sử dụng các chất màu ít tan trong nước hoặc thuốc nhuộm tan trong nước. Ví dụ bao gồm các chất màu đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Thuốc nhuộm Đỏ 112 và C.I. Dung môi đỏ 1. Các chất làm ướt hữu ích có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất mà thúc đẩy việc làm ướt và thường dùng cho các chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông Ưu tiên sử dụng các hợp chất alkylnaphtalensulfonat, như diisopropyl- hoặc diisobutylnaphtalensulfonat. Các chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa hữu ích có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng trong chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông. Ưu tiên sử dụng chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp

gồm các chất phân tán không ion hoặc anion. Các chất phân tán không ion hữu dụng hợp bao gồm đặc biệt là polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristryrylphenol polyglycol ete và các dẫn xuất được phosphat hoá hoặc sulphat hoá của nó. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là các lignosulfonat, các muối của axit polyacrylic và các chất ngưng tụ arylsulfonat/formaldehyt. Các chất chống tạo bọt mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất ức chế bọt thường dùng cho chế phẩm phối chế chứa thành phần hoạt tính hóa nông. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được ưu tiên sử dụng. Các chất bảo quản có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất có thể sử dụng cho mục đích như vậy trong chế phẩm hoá nông. Các ví dụ bao gồm diclophen và hemiformal rượu benzylic. Chất làm đặc thứ cấp mà có thể có mặt trong chế phẩm phối chế xử lý hạt là tất cả các chất có thể sử dụng cho các mục đích như vậy trong chế phẩm hoá nông. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm 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 phối chế xử lý hạt là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyl và tyloza.

Các hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng thích hợp để bảo vệ hạt của giống thực vật bất kỳ mà được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong lâm nghiệp hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn, hạt là hạt ngũ cốc (như lúa mỳ, đại mạch, hắc mạch, kê, tiểu hắc mạch, và yến mạch), cây cải dầu, ngô, bông, đậu tương, lúa gạo, khoai tây, hướng dương, đậu Hà Lan, cà phê, củ cải (ví dụ củ cải đường và củ cải đường cho chăn nuôi), lạc, rau (như cà chua, dưa chuột, hành và rau diếp), bãi cỏ và cây cảnh. Đặc biệt có ý nghĩa là việc xử lý hạt lúa mỳ, đậu tương, cây cải dầu, ngô và lúa gạo.

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

Giun tròn

Trong bối 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 hoạt động trên người và động vật (ví dụ, các loài thuộc bộ Trichinellida, Tylenchida, Rhabditina và Spirurida) và gây ra tổn hại ở hoặc trên các sinh vật sống này và tương tự cả giun sán ký sinh khác.

Chất 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 trưởng thành 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 tỷ lệ giảm đạt được từ 25 đến 50% so sánh 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 tốt nhất 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%. Kiểm soát giun tròn như được mô tả ở đây cũng bao gồm kiểm soát sự tăng sinh của giun tròn (sự phát triển của nang kén và/hoặc trứng). Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng để duy trì thực vật hoặc động vật khỏe mạnh và các hợp chất này cũng được sử dụng theo cách chữa bệnh, phòng ngừa hoặc theo đường hệ thống để phòng trừ giun tròn.

Người có kỹ năng trong lĩnh vực 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 mỗi thể tích đất,

mật độ giun tròn trên mỗi rễ, số lượng trứng giun tròn trên mỗi thể tích đất, sự di chuyển của giun tròn.

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

Trong bối cảnh của sáng chế, thuật ngữ "giun tròn" dùng để chỉ giun tròn ở thực vật bao gồm tất cả các giun tròn mà làm tổn hại cho thực vật. Giun tròn ở thực vật bao gồm giun tròn ký sinh trên thực vật và giun tròn ở 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 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 sinh vật nội ký sinh 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 giống *Heterodera* hoặc *Globodera*, và/hoặc giun tròn tạo nốt sần rễ thuộc giống *Meloidogyne*. Các loại gây hại thuộc các giống này là, ví dụ, *Meloidogyne incognita*, *Heterodera glycines* (giun tròn tạo kén ở đậu tương), *Globodera pallida* và *Globodera rostochiensis* (giun tròn tạo kén ở cà chua vàng), các loài này được kiểm soát một cách hiệu quả bằng các hợp chất được mô tả trong tài liệu này. Tuy nhiên, việc sử dụng hợp chất được mô tả trong tài liệu này không chỉ giới hạn ở các giống hoặc loài này, mà còn mở rộng theo cách tương tự sang 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 nang 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 erythrone*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus nannus*, *Helicotylenchus pseudorobustus* và *Helicotylenchus* spp., *Hemicriconemoides*, *Hemicycliophora arenaria*, *Hemicycliophora nudata*, *Hemicycliophora parvana*, *Heterodera avenae*, *Heterodera cruciferae*, *Heterodera glycines* (giun tròn nang đậu tương), *Heterodera oryzae*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera zeae* và các ký sinh trùng tạo nang 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., *Pratylenchus hamatus*, *Pratylenchus minutus*, *Pratylenchus projectus* và *Pratylenchus* spp., *Pratylenchus agilis*, *Pratylenchus allenii*, *Pratylenchus andinus*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus hamatus*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus loosi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus pratensis*,

Pratylenchus scribneri, *Pratylenchus teres*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zae* và các nội ký sinh trùng di cư *Pratylenchus* spp., *Pseudohalenchus minutus*, *Psilenchus magnidens*, *Psilenchus tumidus*, *Punctodera chalcensis*, *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 the migratory endoparasites *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.

Thực vật mà hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ cho thực vật này bao gồm thực vật như ngũ cốc (ví dụ, lúa, 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 trái / trái cây (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, lơ xanh, rau diếp, hành, 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 hoa bia, cây mía đường, củ cải lấy đường, ô-liu, cao su, cây cọ, cà phê, thuốc lá, cây chè và tương tự), loài cây 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).

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở cà phê, nhất là các loại giun tròn *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..

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở khoai tây, nhất là các loài giun tròn *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus coffeae*, *Ditylenchus dipsaci* và *Pratylenchus alleni*, *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.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở cà chua, nhất là các loài giun tròn *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở dưa chuột, nhất là các loài *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Rotylenchulus reniformis* và *Pratylenchus thornei*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở bông, nhất là các loài *Belonolaimus longicaudatus*, *Meloidogyne incognita*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* và *Rotylenchulus reniformis*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở ngô, nhất là các loài *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor* và cả *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus zaeae*, (*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 zea*, *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở đậu tương, nhất là các loài *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 alleni*, *Pratylenchus agilis*, *Pratylenchus zea*, *Pratylenchus vulnus*, (*Belonolaimus gracilis*), *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne hapla*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* và *Rotylenchulus reniformis*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở thuốc lá, nhất là các loài *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* và cả *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zea*, *Longidorus elongatus*, *Paratrichodorus lobatus*, *Trichodorus* spp., *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Globodera tabacum*, *Globodera solanacearum*, *Globodera virginiae*, *Ditylenchus dipsaci*, *Rotylenchus* spp., *Helicotylenchus* spp., *Xiphinema americanum*, *Criconemella* spp., *Rotylenchulus reniformis*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus* spp. và *Tetylenchus nicotianae*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở cam quýt, nhất là các loài *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở chuối, nhất là các loài *Pratylenchus coffeae*, *Radopholus similis* và cả *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus loosi*, *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus dihystra* và *Rotylenchulus* spp..

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở dứa, nhất là các loài *Pratylenchus zeae*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus goodeyi*., *Meloidogyne* spp., *Rotylenchulus reniformis* và cả *Longidorus elongatus*, *Longidorus laevicapitatus*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus minor*, *Heterodera* spp., *Ditylenchus myceliophagus*, *Hoplolaimus californicus*, *Hoplolaimus pararobustus*, *Hoplolaimus indicus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus nannus*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus erythrone*, *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để phòng trừ giun tròn ở nho, nhất là các loài *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp trong phòng trừ giun tròn ở cây trồng - quả dạng táo, nhất là các loài *Pratylenchus penetrans* và cả *Pratylenchus vulnus*, *Longidorus elongatus*, *Meloidogyne incognita* và *Meloidogyne hapla*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp trong phòng trừ giun tròn cây trồng - quả dạng hạch, nhất là các loài *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Criconemella xenoplax* và of *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*.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp trong phòng trừ giun tròn ở cây trồng, mía đường và lúa, nhất là các loài *Trichodorus* spp., *Criconemella* spp. và cả *Pratylenchus* spp., *Paratrachodorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Aphelenchoides* spp., *Heterodera* spp, *Xiphinema* spp. và *Cacopaurus pestis*.

Ứng dụng

Hợp chất có công thức (I) có thể được áp dụng ở dạng nguyên như vậy, hoặc ví dụ ở dạng dung dịch, 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 ứng dụng được thực hiện theo cách thông thường, ví dụ bằng cách tưới nước, phun, phun sương, phát tán, rắc bụi, tạo bột, rải và tương tự. Cũng có thể triển khai hợp chất có công thức (I) bằng phương pháp thể tích cực thấp, thông qua hệ thống tưới nhỏ giọt hoặc 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 từ 1 đến 150 g trên 100 kg hạt, tốt hơn nữa từ 2,5 đến 25 g trên 100 kg hạt, thậm chí tốt hơn nữa từ 2,5 đến 12,5 g trên 100 kg hạt. Để xử lý đất, tỷ lệ áp dụng có thể nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10 000 g/ha, tốt hơn từ 1 đến 5000 g/ha.

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

Bảo vệ vật liệu

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

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

Các vật liệu công nghiệp theo ngữ cảnh của sáng chế được hiểu có nghĩa là các vật liệu vô tri vô giác mà đã được tạo ra để sử dụng trong công nghiệp. Ví dụ, vật liệu công nghiệp mà cần được bảo vệ tránh khỏi sự biến đổi hoặc phá hủy bởi vi khuẩn có thể là chất kết dính, keo dán, giấy, giấy dán tường và bảng/bìa cứng, hàng dệt, thảm, da, gỗ, sợi và giấy mỏng, sơn và các vật phẩm bằng chất dẻo, các vật liệu bôi trơn làm mát và các vật liệu khác mà chúng có thể bị nhiễm hoặc bị phá hủy bởi vi sinh vật. Các bộ phận của nhà máy sản xuất và các tòa nhà, ví dụ, các đường nước làm lạnh, các hệ thống làm lạnh và gia nhiệt và các bộ phận thông gió và điều hòa không khí, mà các bộ phận này có thể bị tổn hại bởi sự tăng sinh của các vi sinh vật cũng có thể được kể tới trong phạm vi các vật liệu cần được bảo vệ. Vật liệu công nghiệp trong phạm vi của

sáng chế tốt hơn bao gồm chất kết dính, hồ dán, giấy và thẻ, da, gỗ, sơn, vật liệu bôi trơn làm mát và các dịch truyền nhiệt, tốt hơn là gỗ.

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

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

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

Vì sinh vật mà có khả năng làm thoái biến hoặc làm thay đổi vật liệu công nghiệp bao gồm, ví dụ, vi khuẩn, nấm, nấm men, tảo và các sinh vật tạo nhọt. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế tốt hơn là hoạt động chống lại nấm, đặc biệt là nấm mốc, nấm làm phai màu gỗ và nấm phá hủy gỗ (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* và *Zygomycetes*), và chống lại các sinh vật tạo nhọt và tảo. Ví dụ bao gồm các vi sinh vật thuộc các chi sau: *Alternaria*, như *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, như *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, như *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, như *Coniophora puetana*; *Lentinus*, như *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, như *Penicillium*

glaucum; *Polyporus*, như *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, như *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, như *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, như *Trichoderma viride*; *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Hemicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* và *Tyromyces spp.*, *Cladosporium spp.*, *Paecilomyces spp.* *Mucor spp.*, *Escherichia*, như *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, như *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, như *Staphylococcus aureus*, *Candida spp.* và *Saccharomyces spp.*, như *Saccharomyces cerevisiae*.

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

Ví dụ thực hiện sáng chế

Tổng hợp các hợp chất có công thức (I)

Ví dụ điều chế 1: Điều chế S-ethyl 1-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarbothioat (hợp chất I.011)

Bước 1: Điều chế ethyl 1-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat

Dung dịch chứa 1,90 g (11,2 mmol) 2-clo-1,3-dimetylimidazolidinium clorua được hòa tan trong 11,2 mL diclometan được bổ sung vào dung dịch chứa 2,00 g (9,47 mmol) axit 3,4,5-triclothiophen-2-carboxylic và 6,47 mL (37,1 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin được hòa tan trong 75 mL diclometan. Sau 5 phút khuấy, 2,86 g (17,2 mmol) ethyl 1-aminocyclopropanecarboxylat hydroclorua (1:1) được bổ sung và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 24 giờ. Nước được bổ sung và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat khan, lọc và cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradient diclometan/ethyl axetat) để tạo ra 2,48 g (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 84%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 3,41. (M+H) = 342.

Bước 2: Điều chế axit 1-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic

Dung dịch chứa 640 mg (1,86 mmol) ethyl 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylat trong 11,5 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt 4,1 mL dung dịch nước kali hydroxit 1 M (4,1 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được sau đó 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 ethyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được lọc bằng cột Chem Elut™ và được cô đặc trong điều kiện áp suất giảm để thu được 551 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 94%) hợp chất nêu ở đề mục ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,39. (M+H) = 314.

Bước 3: Điều chế S-ethyl 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarbothioat (hợp chất I.011)

Trong môi trường khí trơ, dung dịch chứa 200 mg (0,63 mmol) axit 1-{[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic trong 6,3 mL diclometan khô được bổ sung, ở nhiệt độ trong phòng, 332 μ L (1,90 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin sau đó là 363 mg (0,95 mmol) 1-[bis(dimetylaminometylen)-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridini 3-oxid hexaflophosphat. Sau 15 phút khuấy ở nhiệt độ trong phòng, 59 mg (0,95 mmol) etanthiol được bổ sung và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa được bổ sung và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các pha hữu cơ kết hợp được lọc qua cột silicagel 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 217 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 95%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 4,01. (M+H) = 358.

Ví dụ điều chế 2: Điều chế methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonothioyl]glyxinat (hợp chất I.038)

Bước 1: Điều chế methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat

Dung dịch chứa 250 mg (1,08 mmol) axit 3,4,5-triclothiophen-2-carboxylic và 210 mg (1,67 mmol) ethyl glyxinat hydroclorua (1:1) được hòa tan trong 4,2 mL tetrahydrofuran được bổ sung 0,23 mL (1,62 mmol) trietylamin sau đó là 1,0 mL (1,68 mmol) chứa 50% (khối lượng/khối lượng) dung dịch propanphosphonic anhydrit

trong etyl axetat. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 20 giờ. Hỗn hợp phản ứng được ngừng phản ứng bằng nước và chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô qua magie sulfat, được lọc và được cô đặc trong áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradient *n*-heptan/etyl axetat) để tạo ra 178 mg (độ tinh khiết 93%, hiệu suất 51%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,8. (M+H) = 302.

Bước 2: Điều chế methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonothioyl]glyxinat (hợp chất I.038)

Dung dịch chứa 2,50 g (8,26 mmol) methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat trong 40 mL diclometan được bổ sung 1,67 g (4,13 mmol) chất phản ứng Lawesson. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 50°C trong 72 giờ. Bổ sung tiếp 1,67 g (4,13 mmol) chất phản ứng Lawesson và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 50 °C trong 24 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 1,26 g (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 47%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu vàng. LogP = 4,05. (M+H) = 318.

Ví dụ điều chế 3: Điều chế *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonothioyl]glyxin (hợp chất I.022)

Dung dịch chứa 250 mg (0,78 mmol) methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonothioyl]glyxinat (hợp chất I.038) trong 6,4 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt 1,72 mL dung dịch nước kali hydroxit 1 M (1,72 mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được sau đó 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 lớp hữu cơ kết hợp được lọc bằng cột Chem Elut™ và được cô đặc trong điều kiện áp suất giảm để thu được 230 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 94%) hợp chất nêu ở đề mục ở dạng chất rắn màu cam. LogP = 3,17. (M-H) = 302.

Ví dụ điều chế 4: Điều chế *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin (hợp chất I.022)

Dung dịch chứa 200 mg (0,63 mmol) axit 1-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]amino}xyclopropanecarboxylic, 73 mg (97% độ tinh khiết, 0,76 mmol) aminoaxetonitril hydroclorua (1:1) và 290 mg (0,76 mmol) 1-[bis(dimethylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridini 3-oxid hexaflophosphat trong 5 mL *N,N*-dimetylformamit được bổ sung, ở nhiệt độ trong phòng, 332 μ L (1,90 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 66 giờ. Nước được bổ sung và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat khan, lọc 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 195 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 87%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu vàng. LogP = 2,41. (M+H) = 352.

Ví dụ điều chế 5: Điều chế 3,4,5-triclo-*N*-(xyanometyl)thiophen-2-carboxamit (hợp chất I.025)

Trong môi trường khí trơ, dung dịch chứa 150 mg (0,64 mmol) axit 3,4,5-triclothiophen-2-carboxylic trong 12 mL *N,N*-dimetylformamit, được bổ sung liên tiếp 0,55 mL (3,94 mmol) trietylamin, 198 mg (0,87 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua và 118 mg (0,87 mmol) 1-hydroxybenzotriazol. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Nước được bổ sung và hỗn hợp phản ứng thu được được 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. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột trên silica gel (gradien *n*-heptan/etyl axetat) để tạo ra 103 mg (độ tinh khiết 100%, hiệu suất 59%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,59. (M+H) = 269.

Ví dụ điều chế 6: Điều chế *N*-(2-amino-2-oxoetyl)-3,4,5-triclothiophen-2-carboxamit (hợp chất I.066)

Bước 1: Điều chế *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin

Dung dịch chứa 178 mg (0,59 mmol) methyl *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxinat được hòa tan trong 3 mL tetrahydrofuran được bổ sung từng giọt 1,3 mL dung dịch nước lithi hydroxit 1M (1,3 mmol). Phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng etyl axetat, nước và dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa. Lớp hữu cơ được rửa hai lần bằng dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa. Các lớp nước kết hợp được axit hóa một cách cẩn thận bằng dung dịch nước axit clohydric 37% (khối lượng/khối lượng) ở 0 °C và chiết bằng etyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được làm khô bằng magie sulfat, được lọc và cô trong áp suất giảm để thu được 159 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 92%) *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin ở dạng chất rắn màu trắng. LogP = 2,14. (M-H) = 286.

Bước 2: Điều chế *N*-(2-amino-2-oxoetyl)-3,4,5-triclothiophen-2-carboxamit (hợp chất I.066)

Trong môi trường khí trơ, dung dịch chứa 400 mg (1,39 mmol) *N*-[(3,4,5-triclo-2-thienyl)carbonyl]glyxin trong 20 mL diclometan khô được bổ sung, ở nhiệt độ trong phòng, 111 mg (2,08 mmol) amoni clorua, 399 mg (2,08 mmol) 1-[bis(dimetylamino)metylen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridini 3-oxid hexaflophosphat và 359 mg (2,77 mmol) N,N-diisopropyletylamin. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 2 giờ. Dung dịch nước natri bicacbonat bão hòa được bổ sung và hỗn hợp phản ứng thu được được chiết hai lần bằng diclometan. Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước muối, được làm khô bằng natri sulfat khan, được lọc và được cô trong điều kiện 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 amoni bicacbonat [10 mmol/L]) để tạo ra 255 mg (độ tinh khiết 98%, hiệu suất 63%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. LogP = 1,89. (M+H) = 287.

Ví dụ điều chế 7: Điều chế *N*-(2-amino-2-sulfanylideneetyl)-3,4,5-triclothiophen-2-carboxamit (hợp chất I.104)

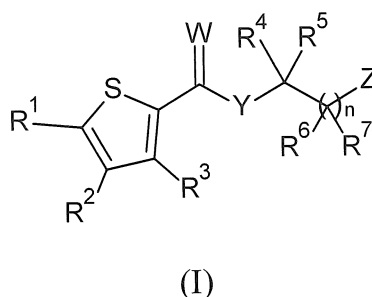
Trong môi trường khí trơ, dung dịch chứa 200 mg (0,66 mmol) *N*-(2-amino-2-oxoetyl)-3,4,5-triclothiophen-2-carboxamit trong 10 mL toluen được bổ sung 400 mg (4,13 mmol) chất phản ứng Lawesson. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 60 °C trong 5 giờ. Hỗn hợp phản ứng thu được được cô dưới áp suất giảm, được pha loãng bằng

nước và chiết bằng ethyl axetat. Các lớp hữu cơ kết hợp được rửa bằng nước muối, được làm khô bằng natri sulfat khan, được lọc và được cô trong điều kiện 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 (0,1%)) để tạo ra 85 mg (độ tinh khiết 45%, hiệu suất 99%) hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn màu trắng. $\text{LogP} = 2,53$. $(\text{M}+\text{H}) = 303$.

Các hợp chất làm ví dụ

Các hợp chất làm ví dụ theo sáng chế như được thể hiện trong các bảng 1a và 1b, 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 1a và 1b dưới đây minh họa các ví dụ không giới hạn về các hợp chất có công thức (I).



Bảng 1a:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
I.001	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-amino-2-oxoethyl	H	0	-	-	carboxy	1,81 ^[a]		
I.002	Cl	Cl	Cl	O	NH	3-amino-3-oxopropyl	H	0	-	-	carboxy	1,73 ^[a]		
I.003	Cl	Cl	Cl	O	NH	1H-indol-3-ylmethyl	H	0	-	-	carboxy	3,31 ^[a]		
I.005	Cl	Cl	Cl	O	NH	cyclopropyl	cyclopropyl	0	-	-	metoxycarbonyl	4,51 ^[a]		
I.006	Cl	Cl	Cl	O	NH	etoxycarbonyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,19 ^[a]		
I.007	Cl	Cl	Cl	O	NH	metoxycarbonyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,31 ^[a]		
I.008	Cl	Cl	Cl	O	NH	3-carbamimidamidopropyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	1,73 ^[a]	(S)	-12,7 °C (c=1,1, DMSO, 25 °C)
I.009	Cl	Cl	Cl	O	NH	CN	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,31 ^[a]		
I.010	Cl	Cl	Cl	S	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	carboxy	3,15 ^[a]		
I.011	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	ethylsulfanylcarbonyl	4,01 ^[a]		

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
I.012	Cl	Cl	Cl	O	NH	1H-imidazol-4-ylmetyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	1,50 ^[a]		
I.013	Cl	Cl	Cl	O	NH	1H-indol-3-ylmetyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,44 ^[a]		
I.014	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-amino-2-oxoetyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	2,11 ^[a]	(R)	
I.015	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-amino-2-oxoetyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	2,16 ^[a]	(S)	+37,2° (c=0,75, MeOH, 20°C)
I.016	Cl	Cl	Cl	O	NH	2,2-difloetyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,55 ^[a]		
I.017	Cl	Cl	Cl	O	NH	metoxy	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,57 ^[a]		
I.018	Cl	Cl	Cl	O	N- OCH ₃	H	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,64 ^[a]		
I.020	Cl	Cl	Cl	S	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	4,12 ^[a]		
I.021	Cl	Cl	Cl	O	N-OH	cyclopropyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,00 ^[a]		
I.022	Cl	Cl	Cl	S	NH	H	H	0	-	-	carboxy	3,17 ^[a]		
I.025	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	CN	2,64 ^[a]		
I.026	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	1	H	H	etoxycarbonyl	3,46 ^[a]		

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
I.027	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		1	-CH ₂ - CH ₂ -		isopropyl/oxy/carbonyl	5,35 ^[a]		
I.032	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	CN	2,88 ^[a]		
I.033	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	CN	3,34 ^[a]		
I.034	Cl	Cl	Cl	O	NH	phenyl	H	0	-	-	CN	3,92 ^[a]		
I.035	Cl	Cl	Cl	O	NH	benzyl	H	0	-	-	CN	4,13 ^[a]		
I.036	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	etyl/sulfanyl/carbonyl	3,75 ^[a]		
I.037	Cl	Cl	Cl	S	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	etoxycarbonyl	4,61 ^[a]		
I.038	Cl	Cl	Cl	S	NH	H	H	0	-	-	metoxycarbonyl	4,05 ^[a]		
I.039	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-methylpropyl	H	0	-	-	etyl/sulfanyl/carbonyl	5,54 ^[a]		
I.040	Cl	Cl	Cl	O	NH	isopropyl	H	0	-	-	etyl/sulfanyl/carbonyl	5,34 ^[a]		
I.041	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	benzyl/sulfanyl/carbonyl	4,56 ^[a]		
I.042	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	phenyl/sulfanyl/carbonyl	4,27 ^[a]		
I.044	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		1	H	H	metoxycarbonyl	3,34 ^[a]		
I.045	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	1	-CH ₂ -		etoxycarbonyl	4,27 ^[a]		

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
								CH ₂ -				
I.046	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-amino-2-oxoethyl	H	0	-	2,35 ^[a]	etoxyacetyl	
I.047	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		1	-CH ₂ -CH ₂ -	4,83 ^[a]	etoxyacetyl	
I.048	Cl	Cl	Cl	O	NH	2,2,2-trifluorethyl	H	0	-	4,27 ^[a]	etoxyacetyl	
I.049	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	2,75 ^[a]	[methoxy(methyl)amino]acetyl	
I.050	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	1,91 ^[a]	(hydroxyamino)acetyl	
I.051	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-methylsulfanylethyl	H	0	-	3,01 ^[a]	carboxy	
I.052	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	2,44 ^[a]	[cyanomethyl(methyl)amino]acetyl	
I.053	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	2,41 ^[a]	(cyanomethylamino)acetyl	
I.054	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	2,01 ^[a]	(methoxyamino)acetyl	
I.055	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	2,14 ^[a]	(methoxyamino)acetyl	
I.056	Cl	Cl	Cl	O	NH	hydroxymethyl	H	0	-	1,94 ^[a]	carboxy	
I.057	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -N(Boc)-CH ₂ -		0	-	4,47 ^[a]	etoxyacetyl	
I.058	Cl	Cl	Cl	O	NH	cyclopropylmethyl	H	0	-	4,81 ^[a]	etoxyacetyl	

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
I.059	Cl	Cl	Cl	O	NH	metoxymetyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,83 ^[a]		
I.060	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	aminocarbonyl	2,00 ^[a]		
I.061	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	[metoxy(metyl)amino]carbonyl	2,77 ^[a]		
I.062	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	(xyanometyl)amino]carbonyl	2,21 ^[a]		
I.063	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	[xyanometyl(metyl)amino]carbonyl	2,62 ^[a]		
I.064	Cl	Cl	Cl	O	NH	phenyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,89 ^[a]		
I.065	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	dimetylaminocarbonyl	2,47 ^[a]		
I.066	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	aminocarbonyl	1,89 ^[a]		
I.067	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-metyl/sulfany/etyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	4,01 ^[a]	(R)	-32,1° (c=0,94, CDCl ₃ , 25°C)
I.068	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-metyl/sulfany/etyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,98 ^[a]		
I.069	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-metyl/sulfany/etyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,98 ^[a]	(S)	+33,1° (c=1,33,

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
														CDCl ₃ , 25°C)
I.070	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	etoxycarbonyl	4,61 ^[a]		
I.071	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,00 ^[a]		
I.072	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,99 ^[a]		
I.073	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	metylcarbonyl	2,07 ^[a]		
I.075	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-carboxyethyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	2,57 ^[a]	(S)	+13° (c=1,08, CDCl ₃ , 25°C)
I.076	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,00 ^[a]		
I.077	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	etoxycarbonyl	3,39 ^[a]		
I.078	Cl	Cl	Cl	O	NH	hydroxymethyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	2,75 ^[a]		
I.079	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -O-CH ₂ -		0	-	-	etoxycarbonyl	3,06 ^[a]		
I.080	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -S-CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,50 ^[a]		
I.081	Cl	Cl	Cl	O	NH	carboxymethyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	2,46 ^[a]	(S)	+28,3°

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
														(c=1,06, MeOH, 20°C)
I.082	Cl	Cl	Cl	O	NH	3-amino-3-oxopropyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	2,19 ^[a]	(S)	-24,5° (c=0,49, DMSO, 25°C)
I.083	Cl	Cl	Cl	O	NH	hydroxymetyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	2,78 ^[a]	(S)	+29,9° (c=1,21, MeOH, 25°C)
I.084	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-metylsulfanyletyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,47 ^[a]		
I.085	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -S-CH ₂ -		0	-	-	etoxycarbonyl	3,92 ^[a]		
I.086	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -		0	-	-	tert-butoxycarbonyl	4,81 ^[a]		
I.087	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	4,48 ^[a]		
I.088	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,65 ^[a]		
I.089	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	H	0	-	-	etyl/sulfanylcarbonyl	4,40 ^[a]	(S)	+9,3°

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ánh	Độ quay quang
														(c=2,16, CDCl ₃ , 25°C)
I.090	Cl	Cl	Cl	O	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	etyl/sulfanylcarbonyl	5,45 ^[a]	(S)	+1,8° (c=1,1, CDCl ₃ , 25°C)
I.091	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	H	0	-	-	metylcarbonyl	2,35 ^[a]	(S)	+16,4° (c=0,49, MeOH, 25°C)
I.092	Cl	Cl	Cl	S	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	6,17 ^[a]	(S)	+68,2° (c=0,85, MeOH, 25°C)
I.093	Cl	Cl	Cl	S	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	5,61 ^[a]	(S)	+74° (c=1, MeOH, 25°C)

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
I.094	Cl	Cl	Cl	O	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	etylcarbamoyl	3,43 ^[a]	(S)	+31,6° (c=0,95, MeOH, 25°C)
I.095	Cl	Cl	Cl	S	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	carboxy	4,30 ^[a]	(S)	+91,8° (c=0,85, MeOH, 25°C)
I.096	Cl	Cl	Cl	O	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	metylcarbamoyl	2,97 ^[a]	(S)	+9,5° (c=1,05, MeOH, 25°C)
I.097	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	tert-butoxycarbonyl	5,28 ^[a]		
I.098	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	cyclopropylmetoxycarbonyl	4,78 ^[a]		
I.099	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	butoxycarbonyl	5,20 ^[a]		
I.100	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	phenylmetoxycarbonyl	5,00 ^[a]		
I.101	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	propoxycarbonyl	4,74 ^[a]		

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
I.102	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	xyclobutyloxyacarbonyl	4,93 ^[a]		
I.103	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	xyclohexyloxyacarbonyl	5,84 ^[a]		
I.104	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	carbamoethioyl	2,53 ^[a]		
I.105	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	carbamoethioyl	2,62 ^[a]		
I.106	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	(xyanoamino)carbonyl	2,45 ^[a]		
I.107	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	(xyanoamino)carbonyl	2,57 ^[a]		
I.108	Cl	Cl	Cl	O	N- OCH ₃	CH ₃	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,15 ^[a]		
I.109	Cl	Cl	Cl	O	N- OCH ₃	CH ₃	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,72 ^[a]		
I.110	Cl	Cl	Cl	O	N-cPr	CH ₃	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,23 ^[a]		
I.111	Cl	Cl	Cl	O	N- OCH ₃	CH ₃	H	0	-	-	carboxy	2,83 ^[a]		
I.112	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metoxycarbonyl	3,69 ^[a]		
I.113	Cl	Cl	Cl	S	NH	CH ₃	H	0	-	-	carboxy	3,50 ^[a]	(S)	+32,1° (c=0,94,

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối xứng	Độ quay quang
														MeOH, 25°C)
I.114	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	metylcarbamoithiyl	3,06 ^[a]		
I.115	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	dimetylcarbamoithiyl	3,20 ^[a]		
I.116	Cl	Cl	Cl	O	N-cPr	H	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,78 ^[a]		
I.117	Cl	Cl	Cl	S	NH	CH ₃	H	0	-	-	metoxycarbonyl	4,62 ^[a]	(S)	+38,4° (c=0,99, MeOH, 25°C)
I.118	Cl	Cl	Cl	S	NH	CH ₃	H	0	-	-	etoxycarbonyl	5,21 ^[a]	(S)	+25,9° (c=1,32, MeOH, 25°C)
I.119	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	H	0	-	-	aminocarbonyl	2,16 ^[a]	(S)	+32,9° (c=1,04, MeOH, 25°C)
I.120	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	H	0	-	-	etylcarbamoithiyl	2,75 ^[a]	(S)	+29,4°

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
														(c=1,09, MeOH, 25°C)
I.122	Cl	Cl	Cl	O	NH	benzyl	CH ₃	0	-	-	metoxycarbonyl	5,11 ^[a]		
I.123	Cl	Cl	Cl	O	NH	CF ₃	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,47 ^[a]		
I.124	Cl	Cl	Cl	O	NH	thiophen-2-yl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	4,22 ^[a]		
I.127	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-(axetylthio)etyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,94 ^[a]		
I.128	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	metylcarbamoithieryl	2,89 ^[a]		
I.129	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	dimetylcarbamoithieryl	3,68 ^[a]		
I.130	Cl	Cl	Cl	O	NH	isopropyl	H	0	-	-	CN	3,81 ^[a]		
I.132	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	CH ₃	0	-	-	CN	3,19 ^[a]		
I.133	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	CN	3,72 ^[a]		
I.135	Cl	Cl	Cl	O	NH	CH ₃	H	1	H	H	metoxycarbonyl	3,64 ^[a]		
I.136	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-tert-butoxy-2-oxoetyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	4,54 ^[a]	(S)	+53,7° (c=1,01, CHCl ₃ ,

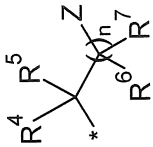
Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ánh	Độ quay quang
														25°C)
I.137	Cl	Cl	Cl	O	NH	3-etoxy-3-oxopropyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,21 ^[a]	(S)	+18,9° (c=0,95, CHCl ₃ , 25°C)
I.138	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-etoxy-2-oxoetyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,12 ^[a]	(S)	+52,6° (c=1,14, CHCl ₃ , 25°C)
I.139	Cl	Cl	Cl	O	NH	3-metoxy-3-oxopropyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,36 ^[a]	(S)	+18,1° (c=0,99, CHCl ₃ , 25°C)
I.140	Cl	Cl	Cl	O	NH	(methylcarbamo- thioylthio)ethyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,52 ^[a]	(R)	+6,8° (c=0,89, CHCl ₃ , 25°C)
I.141	Cl	Cl	Cl	O	NH	(ethylcarbamo- ylthio)ethyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,36 ^[a]	(R)	+17,1°

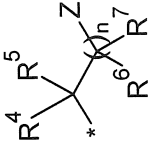
Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân đối ảnh	Độ quay quang
														(c=0,93, CHCl ₃ , 25°C)
I.142	Cl	Cl	Cl	O	NH	[(dimethylaminocarbonyl)thio]methyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,56 ^[a]	(R)	+4,1° (c=1,47, CHCl ₃ , 25°C)
I.143	Cl	Cl	Cl	O	NH	methylsulfanylmethyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	4,29 ^[a]		
I.144	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-methoxy-2-oxoethyl	H	0	-	-	metoxycarbonyl	3,28 ^[a]	(S)	+59,8° (c=1,07, CHCl ₃ , 25°C)
I.145	Cl	Cl	Cl	O	NH	(acetylthio)methyl	H	0	-	-	etoxycarbonyl	3,41 ^[a]		
I.146	Cl	Cl	Cl	O	N-OH	H	H	0	-	-	etoxycarbonyl	2,75 ^[a]		
I.147	Cl	Cl	Cl	O	NH	propan-2-yl	H	0	-	-	aminocarbonyl	2,67 ^[a]	(S)	+41,2° (c=0,97, MeOH, 25°C)

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y	R ⁴	R ⁵	n	R ⁶	R ⁷	Z	LogP	Chất đồng phân	Độ quay quang
I.148	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	(hydroxyamino)carbonyl	1,70 ^[a]		
I.149	Cl	Cl	Cl	O	NH	H	H	0	-	-	[(2- <i>tert</i> -butoxy-2-oxoethyl)amino]carbonyl	3,15 ^[a]		
I.150	Cl	Cl	Cl	O	NH	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		0	-	-	isopropylloxycarbonyl	4,74 ^[a]		

Lưu ý: Độ quay quang: nồng độ c được biểu diễn bằng g/100 mL; cPr có nghĩa là cyclopropyl

Bảng 1b:

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y			LogP	Độ quay quang
I.004	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxopyrrolidin-3-yl		1,98 ^[a]	
I.019	Cl	Cl	Cl	S	NH	2-oxothiolan-3-yl		4,37 ^[a]	
I.023	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxothiolan-3-yl		3,17 ^[a]	
I.024	Cl	Cl	Cl	O	NH	2,2-dimethyl-4-oxothietan-3-yl		4,04 ^[a]	
I.028	Cl	Cl	Cl	O	NH	5-oxopyrrolidin-3-yl		1,86 ^[a]	
I.029	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxooxolan-3-yl		2,48 ^[a]	

Ví dụ số	R ¹	R ²	R ³	W	Y		LogP	Độ quay quang
I.030	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxopiperidin-4-yl	1,93 ^[a]	
I.031	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxopiperidin-3-yl	2,20 ^[a]	
I.043	Cl	Cl	Cl	O	NH	(3S)-2-oxothiolan-3-yl	3,24 ^[a]	+65,1° (c=1,08, CDCl ₃ , 25°C)
I.074	Cl	Cl	Cl	O	NH	(2S)-3-carboxy-1-oxo-1-[[[(2S)-1-methoxy-1-oxo-3-phenylpropan-2-yl]amino]propan-2-yl	3,19 ^[a]	+6° (c=1, DMSO, 25°C)
I.121	Cl	Cl	Cl	O	NH	(3S)-2-oxooxolan-3-yl	2,49 ^[a]	+45,8° (c=1,14, CDCl ₃ , 25°C)
I.125	Cl	Cl	Cl	O	NH	2-oxoazepan-3-yl	2,93 ^[a]	
I.126	Cl	Cl	Cl	O	NH	(3S)-2-oxopiperidin-3-yl	2,24 ^[a]	+92° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.131	Cl	Cl	Cl	O	NH	1-xyano-4-phenylxyclohexyl	5,00 ^[a]	
I.134	Cl	Cl	Cl	O	NH	1-xyano-4-xyclohexylxyclohexyl	6,41 ^[a]	

Lưu ý:“ * “ được liên kế với Y; Độ quay quang: nồng độ c được biểu diễn bằng g/100 mL.

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

[a] Giá trị logP được xác định bằng cách đo LC-UV, trong khoảng axit, với axit formic 0,1% trong nước và axetonitril làm dung môi rửa giải (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

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

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

Nếu có nhiều hơn 1 giá trị LogP trong cùng phương pháp, thì tất cả các giá trị đều 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 (do các giá trị LogP bằng cách 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 bằng cách 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 các 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 có liệt kê giá trị δ theo ppm và cường độ tín hiệu trong ngoặc tròn. Giữa các cặp giá trị δ – cường độ tín hiệu là dấu chấm phẩy làm dấu phân tách.

Danh mục đỉnh làm ví dụ do đó có dạng:

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

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

Để hiệu chỉnh sự chuyển vị hóa học đối với phổ ^1H , các tác giả sử dụng tetrametylsilan và/hoặc sự chuyển vị hóa học của dung môi sử dụng, nhất 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.

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.

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

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

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc các tạp chất 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. Sự tách riêng này có thể sẽ tương tự như việc chọn đỉnh thích hợp trong cách diễn giải ^1H -NMR cổ điển.

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

Bảng A: Danh sách đỉnh NMR

I.001: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,6779 (2,1); 8,6581 (2,2); 7,9539 (2,2); 7,5485 (1,7); 7,0430 (1,8); 4,7298 (0,7); 4,7169 (1,6); 4,7101 (0,9); 4,7035 (0,9); 4,6971 (1,6); 4,6838 (0,7); 2,8931 (16,0); 2,7854 (0,9); 2,7717 (0,9); 2,7453 (2,0); 2,7344 (14,4); 2,7332 (14,5); 2,6922 (1,8); 2,6793 (2,1); 2,6521 (1,0); 2,6394 (0,9); 2,5464 (0,4); 2,5273 (0,3); 2,5225 (0,5); 2,5140 (7,1); 2,5095 (14,4); 2,5050 (19,0); 2,5004 (13,6); 2,4959 (6,5); 0,0080 (0,4); -0,0002 (13,0); -0,0085 (0,5)

I.002: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 12,9202 (0,5); 8,6079 (1,4); 8,5839 (1,4); 7,3722 (1,0); 6,8720 (1,0); 4,4033 (0,4); 4,3871 (0,6); 4,3736 (0,7); 4,3635 (0,7); 4,3496 (0,6); 4,3345 (0,4); 3,3539 (16,0); 2,5278 (7,1); 2,5219 (9,2); 2,5160 (6,7); 2,2461 (0,8); 2,2202 (2,3); 2,1976 (1,8); 2,1642 (0,3); 2,1491 (0,4); 2,1206 (0,5); 2,0964 (0,6); 2,0807 (0,5); 1,9887 (0,5); 1,9669 (0,6); 1,9408 (0,4); 1,9181 (0,3); 0,0193 (4,9)

I.003: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 10,8973 (1,4); 8,1431 (1,4); 8,1247 (1,5); 7,9529 (2,2); 7,5457 (1,6); 7,5260 (1,8); 7,3479 (2,0); 7,3277 (2,3); 7,2085 (2,4); 7,2027 (2,4); 7,0827 (0,9); 7,0802 (0,9); 7,0627 (1,8); 7,0451 (1,1); 7,0425 (1,1); 6,9806 (1,2); 6,9784 (1,3); 6,9609 (2,0); 6,9434 (0,9); 6,9412 (0,9); 4,6783 (0,4); 4,6657 (0,6); 4,6595 (1,0); 4,6472 (1,0); 4,6410 (0,7); 4,6282 (0,5); 3,3678 (0,7); 3,3555 (0,8); 3,3312 (1,5); 3,3191 (1,3); 3,2869 (1,3); 3,2673 (1,2); 3,2501 (0,6); 3,2305 (0,6); 2,8897 (16,0); 2,7328 (13,4); 2,7317 (12,6); 2,5448 (0,7); 2,5253 (0,4); 2,5205 (0,6); 2,5119 (7,4); 2,5075 (14,9); 2,5029 (19,5); 2,4983 (13,9); 2,4938 (6,6); 1,2378 (0,5); 0,0080 (0,5); -0,0002 (12,7); -0,0085 (0,4)

I.004: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,4432 (10,4); 8,4239 (10,4); 7,9534 (1,2); 7,9258 (13,3); 4,4888 (4,4); 4,4677 (7,6); 4,4630 (6,4); 4,4474 (6,2); 4,4427 (7,8); 4,4216 (4,4); 3,3278 (74,1); 3,2611 (1,0); 3,2587 (1,0); 3,2436 (14,1); 3,2376 (9,8); 3,2346 (9,7); 3,2309 (10,5); 3,2205 (16,0); 3,2146 (8,0); 3,2113 (8,3); 3,2075 (10,1); 3,1835 (1,0); 2,8931 (5,7); 2,7342 (4,9); 2,7329 (4,8); 2,6780 (0,5); 2,6734 (0,6); 2,6688 (0,5); 2,5269 (1,9); 2,5221 (2,9); 2,5135 (37,4); 2,5090 (76,8); 2,5044 (101,4); 2,4998 (72,2); 2,4953 (33,9); 2,4117 (2,2); 2,4036 (2,4); 2,3989 (3,3); 2,3904 (4,2); 2,3817 (5,2); 2,3767 (4,6); 2,3689 (5,9); 2,3601 (4,8); 2,3519 (3,0); 2,3468 (3,4); 2,3389 (2,5); 2,3313 (0,8); 2,3267 (0,6); 2,3223 (0,4); 2,0889 (2,7); 2,0657 (7,0); 2,0588 (3,6); 2,0396 (7,4); 2,0356 (6,8); 2,0162 (3,5); 2,0094 (5,9); 1,9861 (2,0); 1,2592 (0,5); 1,2385 (2,4); 0,8532 (0,7); 0,0080 (0,6); -0,0002 (19,3); -0,0085 (0,6)

I.005: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,1531 (2,0); 3,6074 (16,0); 3,3255 (12,5); 2,5252 (0,4); 2,5204 (0,7); 2,5117 (7,9); 2,5073 (16,0); 2,5028 (21,0); 2,4982 (15,5); 2,4937 (7,7); 1,3509 (0,4); 1,3371 (1,0); 1,3297 (1,1); 1,3234 (0,7); 1,3159 (2,0); 1,3094 (0,7); 1,3021 (1,1); 1,2950 (1,1); 1,2811 (0,5); 0,5627 (0,6); 0,5587 (0,8); 0,5499 (1,0); 0,5352 (1,5); 0,5255 (0,9); 0,5210 (1,1); 0,5131 (0,4); 0,5001 (0,5); 0,4859 (0,4); 0,4781 (1,1); 0,4693 (1,0); 0,4633 (3,8); 0,4577 (1,9); 0,4483 (1,6); 0,4419 (3,9); 0,4270 (1,4); 0,4239 (1,1); 0,4159 (1,2); 0,4107 (0,9); 0,4016 (1,5); 0,3966 (0,9); 0,3913 (0,8); 0,3874 (1,3); 0,3776 (0,8); 0,3739 (0,6); -0,0002 (5,5)

I.006: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,8460 (1,0); 8,8308 (1,0); 5,2379 (1,9); 5,2224 (1,9); 4,2690 (1,0); 4,2598 (0,9); 4,2513 (1,1); 4,2421 (3,0); 4,2352 (1,2); 4,2243 (3,2); 4,2176 (3,1); 4,2066 (1,3); 4,1999 (3,0); 4,1907 (1,1); 4,1821 (1,0); 4,1729 (1,0); 4,1552 (0,3); 3,7533 (0,4); 3,3266 (8,5); 2,8919 (0,4); 2,7321 (0,3); 2,5252 (0,4); 2,5116 (8,1); 2,5074 (15,9); 2,5029 (20,8); 2,4984 (15,3); 2,4941 (7,7); 1,2393 (8,1); 1,2216 (16,0); 1,2038 (7,7); -0,0002 (5,0)

I.007: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,9099 (0,6); 8,8952 (0,6); 5,3067 (0,9); 5,2916 (0,9); 3,7529 (16,0); 3,3293 (3,4); 2,5076 (7,2); 2,5031 (9,5); 2,4987 (7,2); -0,0002 (2,2)

I.008: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7118 (1,6); 8,6869 (1,6); 7,4856 (0,7); 7,4670 (1,3); 7,4483 (0,7); 4,5110 (0,4); 4,4938 (0,6); 4,4814 (0,8); 4,4688 (0,7); 4,4564 (0,6); 4,4389 (0,4); 3,6982 (16,0); 3,3588 (15,9); 3,1717 (0,7); 3,1495 (1,8); 3,1289 (1,8); 3,1066 (0,7); 2,5338 (1,2); 2,5281 (2,5); 2,5222 (3,4); 2,5162 (2,5); 1,9181 (0,4); 1,8909 (0,7); 1,8739 (0,6); 1,8635 (0,5); 1,8465 (0,4); 1,8266 (0,6); 1,8044 (0,6); 1,7774 (0,5); 1,6172 (0,4); 1,5920 (1,1); 1,5665 (1,3); 1,5434 (0,8); 0,0182 (1,3)

I.009: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,5247 (4,3); 9,5071 (4,2); 5,9853 (5,3); 5,9676 (5,1); 4,2718 (2,9); 4,2542 (7,9); 4,2368 (7,9); 4,2198 (2,7); 3,3137 (111,2); 2,8995 (0,9); 2,7409 (0,9); 2,5101 (19,9); 1,2577 (8,4); 1,2401 (16,0); 1,2226 (8,0)

I.010: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 12,7158 (0,8); 10,7156 (3,4); 4,0611 (0,4); 4,0373 (0,4); 3,3519 (16,0); 2,5345 (3,0); 2,5286 (6,4); 2,5226 (8,9); 2,5166 (6,5); 2,5108 (3,1); 2,0097 (1,8); 1,5906 (1,7); 1,5734 (4,4); 1,5625 (4,9); 1,5477 (2,2); 1,3096 (2,2); 1,2948 (4,7); 1,2839 (4,6); 1,2669 (1,7); 1,2187 (0,6); 1,1950 (1,0); 1,1713 (0,5); 0,0202 (5,2)

I.011: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5702 (2,4); 7,2986 (4,2); 2,9487 (2,4); 2,9238 (7,5); 2,8990 (7,7); 2,8743 (2,6); 1,8498 (2,4); 1,8331 (6,7); 1,8216 (6,9); 1,8062 (2,8); 1,6110 (2,7); 1,4247 (2,9); 1,4093 (7,0); 1,3978 (6,8); 1,3810 (2,4); 1,2958 (8,1); 1,2710 (16,0); 1,2462 (7,6); 0,0339 (5,4)

I.012: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8824 (1,2); 8,8640 (1,2); 8,1408 (0,5); 8,1106 (0,6); 8,0005 (2,3); 7,9537 (0,9); 7,0868 (0,7); 7,0582 (2,9); 4,7773 (0,5); 4,7618 (1,2); 4,7437 (1,3); 4,7277 (0,5); 3,6492 (16,0); 3,1698 (0,4); 3,1275 (3,0); 3,1119 (2,9); 2,8922 (6,4); 2,7333 (5,1); 2,7322 (5,5); 2,5270 (0,6); 2,5222 (0,7); 2,5135 (9,4); 2,5090 (19,2); 2,5045 (25,3); 2,4999 (18,5); 2,4954 (9,1); 1,2386 (0,5); -0,0002 (3,4)

I.013: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 10,9140 (2,7); 8,3559 (2,4); 8,3378 (2,4); 8,3160 (0,3); 7,5191 (3,0); 7,4995 (3,2); 7,3555 (3,4); 7,3353 (4,0); 7,2283 (4,2); 7,2228 (4,3); 7,0893 (1,6); 7,0717 (3,1); 7,0517 (1,9); 6,9950 (2,3); 6,9770 (3,3); 6,9579 (1,4); 4,7003 (0,8); 4,6811 (2,0); 4,6674 (1,8); 4,6630 (1,6); 4,6485 (0,9); 4,1335 (2,2); 4,1158 (7,1); 4,0981 (7,2); 4,0803 (2,3); 3,3448 (1,1); 3,3302 (26,2); 3,3088 (2,6); 3,2950 (2,4); 3,2826 (2,4); 3,2625 (2,3); 3,2460 (0,8); 3,2259 (0,8); 2,8899 (1,0); 2,7319 (0,9); 2,5068 (35,6); 2,5024 (46,4); 2,4981 (35,7); 1,2377 (1,1); 1,1720 (7,8); 1,1542 (16,0); 1,1365 (7,5); -0,0002 (5,2)

I.014: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 8,3831 (0,6); 8,3572 (0,6); 7,2985 (3,6); 5,6844 (0,5); 5,5935 (0,5); 5,0550 (0,5); 5,0411 (1,1); 5,0279 (1,0); 5,0147 (1,0); 5,0008 (0,5); 3,8344 (16,0); 3,1799 (1,0); 3,1664 (1,0); 3,1251 (1,5); 3,1116 (1,4); 2,9397 (1,4); 2,9253 (1,5); 2,8849 (1,0); 2,8705 (0,9); 1,6664 (1,0); 0,0336 (4,5)

I.015: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7321 (1,4); 8,7163 (1,5); 7,5479 (1,1); 7,0575 (1,1); 4,8534 (0,5); 4,8428 (1,1); 4,8377 (0,7); 4,8319 (0,7); 4,8270 (1,1); 4,8161 (0,5); 3,6563 (16,0); 3,3218 (3,4); 2,7867 (0,6); 2,7754 (0,6); 2,7545 (1,6); 2,7433 (1,6); 2,7264 (1,6); 2,7160 (1,7); 2,6941 (0,6); 2,6839 (0,6); 2,5088 (0,6); 2,5052 (0,9); 2,5016 (0,7); 2,4982 (0,3); 1,9904 (0,6)

I.016: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,8052 (0,4); 7,7838 (0,5); 7,2988 (6,4); 6,2165 (0,5); 6,0460 (0,5); 6,0310 (1,0); 6,0162 (0,5); 5,8456 (0,5); 4,9875 (0,5); 4,9656 (0,9); 4,9480 (0,8); 4,9436 (0,7); 4,9261 (0,5); 3,8807 (16,0); 2,6841 (0,3); 2,6287 (0,4); 2,5746 (0,3); 2,5447 (0,3); 2,5268 (0,4); 2,4743 (0,4); 1,5910 (6,1); 0,0369 (7,6)

I.017: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 8,0189 (0,8); 8,0027 (0,8); 7,2658 (1,5); 5,6654 (2,5); 5,6483 (2,4); 4,3431 (1,4); 4,3288 (3,8); 4,3145 (3,8); 4,3003 (1,3); 3,5461 (16,0); 1,6023 (1,6); 1,3720 (4,3); 1,3577 (8,0); 1,3434 (4,0); 1,2548 (0,6); -0,0002 (1,4)

I.018: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2988 (1,5); 4,4868 (8,9); 4,3043 (1,1); 4,2804 (3,3); 4,2566 (3,4); 4,2328 (1,1); 3,7945 (16,0); 1,6251 (2,4); 1,3425 (3,9); 1,3187 (7,9); 1,2949 (3,8); 0,0321 (2,0)

I.019: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 10,5044 (14,6); 10,4884 (15,4); 8,6132 (0,3); 8,5971 (0,4); 7,8335 (0,4); 7,8210 (0,6); 7,8062 (0,5); 7,7922 (0,5); 7,7749 (0,3); 7,3834 (0,3); 7,1684 (0,4); 7,1587 (0,5); 7,1548 (0,5); 7,1416 (0,5); 7,1365 (0,5); 7,1251 (0,9); 7,1183 (0,9); 7,1075 (0,8); 7,0481 (0,3); 7,0427 (0,4); 7,0319 (0,4); 5,7551 (7,0); 5,5650 (8,0); 5,5499 (13,0); 5,5398 (11,0); 5,5347 (10,9); 5,5244 (13,9); 5,5095 (9,0); 4,2990 (0,7); 4,2926 (0,7); 4,1585 (0,3); 4,1394 (0,3); 4,1247 (0,5); 4,1145 (0,7); 4,0426 (2,2); 4,0301 (2,5); 4,0188 (1,7); 4,0090 (0,9); 4,0002 (2,2); 3,9961 (1,2); 3,9889 (0,8); 3,9845 (0,9); 3,8739 (1,2); 3,8578 (1,7); 3,8508 (1,5); 3,8455 (2,2); 3,8375 (1,0); 3,8323 (1,0); 3,8277 (1,6); 3,8233 (1,9); 3,8122 (1,9); 3,8080 (1,6); 3,7958 (0,4); 3,5664 (6,7); 3,5556 (8,5); 3,5434 (15,4); 3,5327 (16,0); 3,5204 (12,3); 3,5096 (10,6); 3,4667 (0,6); 3,4547 (0,7); 3,4435 (0,7); 3,4213 (14,2); 3,4072 (15,6); 3,3993 (12,8); 3,3863 (11,8); 3,3324 (36,1); 3,2368 (0,6); 3,2254 (0,4); 3,2085 (0,5); 3,1947 (0,6); 3,1803 (0,5); 3,1729 (0,5); 3,0876 (0,4); 3,0731 (0,5); 3,0556 (0,5); 3,0470 (0,6); 3,0329 (0,6); 3,0184 (0,5); 3,0101 (0,4); 2,9540 (0,3); 2,9102 (0,4); 2,8990 (0,4); 2,8810 (0,4); 2,8747 (0,5); 2,8362 (0,8); 2,7967 (0,3); 2,7796 (0,3); 2,7140 (6,1); 2,7025 (10,3); 2,6895 (13,4); 2,6782 (12,1); 2,6666 (7,5); 2,5079 (22,1); 2,5045 (30,1); 2,5011 (23,8); 2,3624 (4,8); 2,3483 (5,7); 2,3380 (12,5); 2,3237 (13,2); 2,3135 (13,1); 2,2992 (12,1); 2,2891 (5,4); 2,2749 (4,2); 2,2440 (0,4); 2,1133 (1,1); 2,0936 (1,2); 2,0858 (1,5); 2,0763 (0,9); 1,8210 (0,5); 1,8140 (0,6); 1,5955 (0,5); 1,5679 (0,6); 1,5524 (0,4); 1,5385 (0,4); 1,4689 (0,6); 1,4628 (0,6); 1,4567 (0,7); 1,4519 (0,8); 1,4472 (0,8); 1,4368 (1,4); 1,4280 (2,1); 1,4210 (1,2); 1,4048 (2,7); 1,3897 (1,4); 1,3766 (1,1); 1,3626 (1,0); 1,3554 (1,0); 1,3453 (1,6); 1,3387 (1,3); 1,3314 (1,2); 1,3176 (1,0); 1,3128 (0,8); 1,2919 (2,7); 1,2864 (1,5); 1,2618 (1,0); 1,2478 (1,3); 1,2348 (4,6); 1,2044 (1,3); 1,1903 (1,8); 1,1769 (1,6); 1,1643 (1,4); 1,1503 (1,0); 1,1239 (0,5); 1,1104 (0,5); 1,0725 (0,3); 1,0595 (0,3); 0,8668 (0,4); 0,8551 (0,7); 0,8408 (0,5); 0,7865 (0,4); 0,7618 (0,4)

I.020: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 8,9628 (0,6); 7,2989 (2,0); 3,7571 (16,0); 1,8555 (1,0); 1,8379 (2,7); 1,8275 (2,6); 1,8109 (1,2); 1,6039 (1,4); 1,4448 (1,2); 1,4282 (2,6); 1,4179 (2,7); 1,4003 (1,0); 0,0355 (2,7)

I.021: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 11,0770 (3,1); 4,2768 (2,0); 4,2430 (2,1); 3,6916 (16,0); 3,3489 (2,9); 2,9109 (0,9); 2,7518 (0,7); 2,5342 (2,4); 2,5282 (5,1); 2,5222 (6,9); 2,5161 (5,0); 2,5101 (2,3); 1,4015 (0,3); 1,3921 (0,5); 1,3843 (0,4); 1,3752 (0,5); 1,3666 (0,4); 1,3584 (0,5); 1,3482 (0,3); 0,7443 (0,5); 0,7390 (0,4); 0,7317 (0,8); 0,7247 (0,4); 0,7163 (0,4); 0,7121 (0,4); 0,7025 (0,5); 0,6968 (0,5); 0,6111 (0,5); 0,5973 (0,7); 0,5873 (1,1); 0,5815 (1,3); 0,5712 (0,8); 0,5632 (1,7); 0,5461 (0,5); 0,5329 (0,3); 0,3800 (0,4); 0,3727 (0,5); 0,3641 (0,8); 0,3446 (0,7); 0,3282 (0,4); 0,0197 (4,3)

I.022: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 13,1037 (0,4); 13,0660 (0,4); 12,9856 (0,4); 10,3315 (4,2); 4,4341 (16,0); 4,4205 (16,0); 4,0622 (0,8); 4,0385 (0,8); 3,9914 (0,4); 3,9723 (0,4); 3,3486 (1,0); 3,1859 (0,4); 2,5348 (5,7); 2,5288 (12,2); 2,5228 (16,9); 2,5167 (12,4); 2,5109 (5,8); 2,0095 (3,4); 1,9299 (1,0); 1,3763 (0,8); 1,2540 (0,8); 1,2196 (1,2); 1,1958 (2,3); 1,1721 (1,1); 0,0313 (0,6); 0,0205 (18,5); 0,0096 (0,7)

I.023: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,6132 (15,9); 8,5930 (16,0); 8,3092 (1,1); 7,9530 (0,5); 4,8315 (6,9); 4,8125 (11,3); 4,7997 (9,4); 4,7937 (8,9); 4,7804 (11,9); 4,7619 (7,1); 3,4847 (5,6); 3,4712 (7,0); 3,4563 (12,8); 3,4429 (13,1); 3,4272 (11,4); 3,4136 (9,5); 3,3455 (146,1); 3,3383 (222,5); 3,3111 (9,8); 2,8948 (3,2); 2,7356 (2,9); 2,6791 (0,8); 2,6747 (1,0); 2,6703 (0,8); 2,5730 (0,4); 2,5514 (0,8); 2,5233 (11,7); 2,5102 (138,2); 2,5058 (172,2); 2,5013 (125,8); 2,4970 (72,4); 2,4796 (12,8); 2,4649 (7,1); 2,3995 (4,3); 2,3819 (5,2); 2,3689 (10,6); 2,3510 (11,0); 2,3380 (10,3); 2,3203 (9,4); 2,3075 (3,7); 2,2898 (2,8); 1,2996 (0,4); 1,2602 (0,8); 1,2385 (3,4); 0,8541 (0,8); 0,8361 (0,3); -0,0001 (4,7)

I.024: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,5446 (0,4); 9,4108 (1,6); 9,3904 (1,7); 8,9212 (1,1); 8,8985 (1,1); 8,3091 (0,6); 8,1747 (0,5); 7,9527 (0,7); 7,2258 (0,7); 7,0980 (0,7); 6,9704 (0,7); 5,7778 (3,8); 5,7570 (3,8); 5,0462 (2,4); 5,0237 (2,4); 4,6504 (0,3); 4,5509 (0,4); 4,5292 (0,4); 3,5352 (0,5); 3,3562 (45,4); 3,2238 (1,4); 3,2022 (1,4); 3,1767 (2,3); 3,1585 (0,6); 3,1505 (0,6); 3,1351 (0,8); 3,0368 (0,7); 2,9870 (2,7); 2,8946 (5,0); 2,8828 (2,0); 2,8678 (3,1); 2,7351 (4,2); 2,6793 (0,5); 2,6749 (0,7); 2,6704 (0,5); 2,6326 (0,9); 2,6252 (0,4); 2,5511 (0,5); 2,5371 (0,4); 2,5282 (1,7); 2,5145 (38,3); 2,5104 (77,7); 2,5059 (103,3); 2,5015 (79,2); 2,4418 (0,4); 2,3604 (15,2); 2,3421 (0,6); 2,3372 (0,7); 2,3326 (0,9); 2,2817 (15,8); 2,1077 (0,7); 2,0884 (0,4); 2,0362 (0,4); 1,9562 (0,4); 1,9156 (0,5); 1,8336 (0,8); 1,7899 (16,0); 1,7521 (2,6); 1,7345 (0,5); 1,6863 (2,9); 1,6767 (15,4); 1,5993 (3,3); 1,5824 (0,4); 1,5562 (1,0); 1,5099 (12,1); 1,4997 (2,7); 1,4841 (12,0); 1,4643 (1,6); 1,4415 (1,9); 1,4321 (2,7); 1,4247 (2,1); 1,3950 (1,4); 1,3469 (1,0); 1,3404 (1,0); 1,3134 (1,2); 1,2988 (0,5); 1,2925 (0,4); 1,2803 (0,7); 1,2693 (1,0); 1,2646 (1,2); 1,2375 (2,7); 1,1939 (0,3); 1,1702 (0,5); 1,0894 (0,5); 0,9543 (0,4); 0,8534 (0,6); -0,0002 (2,3)

I.025: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2598 (13,8); 7,2098 (0,5); 4,4032 (5,3); 4,3916 (5,3); 1,5383 (16,0); 1,2532 (0,6); -0,0002 (12,0)

I.026: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6617 (0,7); 7,2984 (5,1); 4,2579 (2,1); 4,2341 (6,6); 4,2103 (6,7); 4,1865 (2,2); 3,8015 (2,0); 3,7817 (4,3); 3,7623 (4,5); 3,7421 (2,1); 2,6951 (3,8); 2,6752 (5,0); 2,6560 (3,6); 1,6343 (5,3); 1,4657 (2,5); 1,3395 (7,9); 1,3157 (16,0); 1,3036 (0,4); 1,2918 (7,9); 0,0332 (4,5)

I.027: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 8,0222 (1,1); 7,2990 (2,1); 5,1152 (0,4); 5,0943 (1,0); 5,0735 (1,4); 5,0527 (1,1); 5,0318 (0,4); 1,6429 (2,3); 1,2938 (16,0); 1,2730 (15,8); 1,2302 (0,9); 1,2192 (1,1); 1,2136 (2,2); 1,2041 (3,5); 1,1925 (1,5); 1,1557 (0,4); 1,1427 (0,4); 1,1060 (1,6); 1,0944 (3,7); 1,0790 (3,9); 1,0748 (3,5); 1,0693 (2,5); 1,0553 (1,4); 0,8320 (1,3); 0,8126 (2,9); 0,8086 (2,9); 0,7883 (1,0); 0,0331 (2,6)

I.028: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7039 (1,6); 8,3158 (16,0); 7,6923 (1,3); 4,5995 (0,4); 4,5862 (0,7); 4,5781 (0,7); 4,5741 (0,7); 4,5667 (1,2); 4,5592 (0,7); 4,5551 (0,7); 4,5469 (0,7); 4,5338 (0,4); 3,5945 (1,3); 3,5752 (1,5); 3,5712 (1,6); 3,5513 (1,4); 3,3298 (6,4); 3,3062 (2,2); 3,1829 (1,4); 3,1712 (1,4); 3,1578 (1,2); 3,1462 (1,2); 2,8927 (1,0); 2,7330 (0,9); 2,5568 (2,2); 2,5351 (2,3); 2,5265 (0,5); 2,5135 (10,4); 2,5087 (18,1); 2,5042 (23,6); 2,4996 (16,9); 2,4948 (8,9); 2,2670 (2,5); 2,2530 (2,4); 2,2250 (1,9); 2,2110 (1,9); 1,2378 (0,7); -0,0002 (2,3)

I.029: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7609 (9,4); 8,3156 (16,0); 4,8230 (6,6); 4,7996 (8,4); 4,7961 (9,1); 4,7728 (6,9); 4,4243 (3,5); 4,4198 (3,9); 4,4022 (9,3); 4,3976 (9,1); 4,3802 (5,6); 4,3755 (4,8); 4,3026 (4,5); 4,2859 (5,8); 4,2808 (4,5); 4,2765 (6,0); 4,2640 (4,4); 4,2598 (5,8); 4,2548 (5,0); 4,2381 (3,6); 4,0119 (0,4); 3,3287 (39,4); 3,3049 (3,2); 2,8928 (1,7); 2,7341 (1,4); 2,7329 (1,5); 2,7118 (0,3); 2,6778 (0,4); 2,6731 (0,6); 2,6685 (0,4); 2,5750 (0,4); 2,5267 (1,7); 2,5220 (2,5); 2,5133 (33,0); 2,5088 (68,4); 2,5042 (89,4); 2,4996 (63,0); 2,4950 (29,5); 2,4848 (3,3); 2,4772 (4,2); 2,4721 (3,6); 2,4671 (2,6); 2,4605 (4,1); 2,4544 (4,4); 2,4490 (3,4); 2,4370 (3,0); 2,4324 (2,6); 2,4129 (2,6); 2,3901 (3,7); 2,3865 (5,3); 2,3634 (5,7); 2,3601 (5,2); 2,3569 (4,0); 2,3365 (3,4); 2,3338 (3,6); 2,3301 (2,7); 2,3071 (1,5); 1,2700 (0,4); 1,2591 (0,5); 1,2379 (2,6); 0,8530 (0,7); -0,0002 (10,1)

I.030: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,3746 (0,4); 8,3092 (16,0); 7,5894 (0,5); 4,1759 (0,4); 4,1629 (0,4); 4,1537 (0,4); 3,3336 (4,8); 3,3095 (3,4); 3,2064 (0,6); 3,1931 (1,4); 3,1804 (1,0); 3,1685 (0,6); 3,1574 (0,6); 2,8947 (0,4); 2,7356 (0,4); 2,5227 (0,4); 2,5140 (4,8); 2,5097 (9,8); 2,5053 (12,8); 2,5008 (9,3); 2,4964 (4,6); 2,4750 (0,5); 2,4463 (0,8); 2,4319 (0,8); 2,3126 (0,9); 2,2903 (0,9); 2,2696 (0,6); 2,2474 (0,6); 1,9606 (0,4); 1,9506 (0,4); 1,9391 (0,4); 1,9287 (0,5); 1,9186 (0,5); 1,7789 (0,4); 1,7650 (0,4); 1,7558 (0,4); 1,7465 (0,4); 1,2387 (0,4); -0,0002 (1,2)

I.031: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,3789 (1,5); 8,3615 (1,5); 8,3155 (16,0); 7,7499 (1,8); 4,3167 (0,4); 4,3007 (1,0); 4,2902 (1,1); 4,2764 (1,2); 3,3279 (15,9); 3,3042 (5,0); 3,1621 (3,5); 3,1558 (3,2); 2,8925 (1,2); 2,7331 (1,1); 2,5080 (28,2); 2,5038 (36,2); 2,4997 (27,0); 2,1688 (0,6); 2,1479 (1,3); 2,1425 (1,4); 2,1323 (0,8); 2,1267 (0,8); 2,1165 (0,5); 1,8501 (0,4); 1,8313 (1,6); 1,8182 (1,5); 1,8102 (2,2); 1,7988 (3,2); 1,7837 (1,6); 1,7742 (2,4); 1,7609 (1,0); 1,7498 (1,0); 1,2383 (1,2); -0,0002 (2,6)

I.032: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,2755 (7,0); 8,3158 (0,4); 3,3289 (42,3); 2,6775 (0,4); 2,6729 (0,5); 2,6683 (0,4); 2,5265 (1,4); 2,5217 (1,9); 2,5130 (30,7); 2,5085 (64,2); 2,5039 (84,2); 2,4993 (59,1); 2,4947 (27,6); 2,3353 (0,4); 2,3307 (0,5); 2,3261 (0,4); 1,6455 (0,3); 1,6075 (7,2); 1,5933 (15,6); 1,5862 (15,7); 1,5726 (8,6); 1,5325 (0,8); 1,3695 (0,7); 1,3295 (8,9); 1,3158 (15,3); 1,3089 (16,0); 1,2944 (7,0); 1,2565 (0,4); 1,2383 (0,6); -0,0002 (8,4)

I.033: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2603 (43,6); 7,2207 (5,0); 2,9302 (3,2); 2,9238 (2,5); 2,9177 (4,0); 2,9081 (4,8); 2,9030 (4,8); 2,8961 (7,4); 2,8846 (5,5); 2,8751 (4,8); 2,8706 (2,8); 2,8631 (4,5); 2,5153 (3,0); 2,4940 (6,1); 2,4910 (6,7); 2,4703 (5,8); 2,4619 (6,4); 2,4383 (3,7); 2,3499 (0,9); 2,3284 (2,2); 2,3207 (1,4); 2,3078 (3,0); 2,2992 (3,5); 2,2871 (2,0); 2,2783 (4,6); 2,2575 (2,8); 2,2358 (0,7); 2,2167 (1,1); 2,2047 (2,2); 2,1924 (2,6); 2,1809 (3,8); 2,1752 (2,1); 2,1693 (2,7); 2,1632 (2,2); 2,1571 (2,1); 2,1514 (2,5); 2,1445 (1,2); 2,1397 (1,6); 2,1275 (1,1); 2,1149 (0,5); 1,5837 (0,3); 1,5452 (58,3); 1,4994 (0,4); 1,3222 (1,2); 1,3044 (2,9); 1,2654 (14,0); 0,8988 (6,2); 0,8821 (16,0); 0,8645 (7,1); -0,0002 (55,0); -0,0449 (0,3)

I.034: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,7205 (3,9); 9,7024 (3,9); 7,9533 (0,8); 7,5656 (6,0); 7,5643 (5,8); 7,5607 (8,7); 7,5567 (2,7); 7,5470 (7,2); 7,5448 (11,8); 7,5433 (14,0); 7,5418 (13,0); 7,5357 (1,6); 7,4997 (4,6); 7,4960 (6,9); 7,4910 (2,5); 7,4785 (16,0); 7,4744 (5,8); 7,4635 (4,6); 7,4600 (9,1); 7,4538 (1,2); 7,4467 (3,8); 7,4432 (6,9); 7,4397 (3,6); 7,4319 (2,0); 7,4257 (6,6); 7,4178 (1,2); 7,4106 (1,1); 7,4074 (1,7); 7,4045 (0,8); 6,3535 (5,6); 6,3354 (5,6); 3,3561 (0,3); 3,3501 (0,5); 3,3336 (111,2); 2,8914 (5,3); 2,7332 (4,4); 2,7318 (4,4); 2,6770 (0,4); 2,6722 (0,5); 2,6678 (0,4); 2,5258 (1,4); 2,5211 (2,0); 2,5124 (30,2); 2,5079 (62,8); 2,5034 (82,2); 2,4987 (57,3); 2,4942 (26,6); 2,3347 (0,4); 2,3302 (0,5); 2,3255 (0,4); 1,2389 (0,8); -0,0002 (0,7)

I.035: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,1086 (2,0); 7,3582 (1,0); 7,3451 (16,0); 7,3377 (8,4); 7,3319 (7,7); 7,3310 (7,8); 7,3248 (0,9); 7,3169 (0,8); 7,3130 (1,1); 7,3107 (1,2); 7,3001 (0,4); 7,2885 (1,4); 7,2816 (1,7); 7,2757 (1,3); 7,2722 (1,2); 7,2668 (1,8); 7,2587 (0,9); 7,2534 (0,7); 7,2454 (0,4); 5,1429 (1,4); 5,1217 (2,2); 5,1034 (1,4); 3,3386 (61,1); 3,2867 (0,7); 3,2686 (0,8); 3,2530 (3,2); 3,2380 (4,1); 3,2168 (3,1); 3,2048 (0,8); 3,1831 (0,8); 2,5265 (0,7); 2,5218 (1,1); 2,5131 (14,2); 2,5086 (29,0); 2,5041 (37,6); 2,4994 (26,1); 2,4949 (11,9)

I.036: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,8535 (1,6); 4,1984 (4,7); 3,3160 (13,9); 2,8761 (2,2); 2,8614 (6,9); 2,8466 (7,0); 2,8318 (2,3); 2,5084 (0,8); 2,5050 (1,8); 2,5014 (2,4); 2,4978 (1,8); 2,4945 (0,9); 1,1863 (7,7); 1,1716 (16,0); 1,1568 (7,4)

I.037: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

$\delta =$ 8,9415 (1,3); 7,2988 (11,1); 4,2595 (2,4); 4,2358 (7,5); 4,2120 (7,6); 4,1883 (2,5); 1,8443 (2,2); 1,8267 (5,8); 1,8163 (5,6); 1,7999 (2,6); 1,5890 (9,1); 1,4856 (0,3); 1,4325 (2,6); 1,4161 (5,6); 1,4057 (5,8); 1,3882 (2,1); 1,2990 (8,0); 1,2753 (16,0); 1,2515 (7,6); 0,0478 (0,5); 0,0370 (13,5); 0,0261 (0,4)

I.038: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

$\delta =$ 9,3394 (0,4); 7,2990 (1,6); 4,5890 (4,7); 4,5745 (4,7); 3,9048 (16,0); 1,5947 (1,2); 0,0354 (2,3)

I.039: $^1\text{H-NMR}$ (600,4 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,9007 (1,8); 8,8877 (1,8); 4,5620 (0,7); 4,5550 (0,9); 4,5490 (0,8); 4,5439 (1,1); 4,5423 (1,2); 4,5371 (0,9); 4,5311 (0,9); 4,5239 (0,8); 3,3540 (2,5); 3,3352 (9,1); 3,3283 (11,9); 3,3270 (12,4); 3,3242 (19,2); 3,3220 (26,8); 3,3209 (28,3); 3,3197 (36,4); 2,8943 (0,9); 2,8442 (1,9); 2,8319 (6,2); 2,8197 (6,5); 2,8074 (2,2); 2,7353 (0,8); 2,5252 (0,4); 2,5221 (0,4); 2,5190 (0,4); 2,5103 (8,4); 2,5073 (19,0); 2,5042 (26,9); 2,5011 (19,1); 2,4980 (8,6); 1,7830 (0,6); 1,7756 (0,8); 1,7649 (0,7); 1,7606 (0,9); 1,7576 (1,0); 1,7533 (1,0); 1,7428 (0,7); 1,7353 (1,0); 1,7099 (0,4); 1,6989 (0,6); 1,6946 (0,6); 1,6917 (0,5); 1,6875 (0,7); 1,6837 (0,7); 1,6761 (0,7); 1,6729 (0,6); 1,6653 (0,5); 1,6267 (1,1); 1,6195 (1,2); 1,6111 (0,7); 1,6042 (1,6); 1,5973 (0,8); 1,5888 (0,6); 1,5819 (0,6); 1,1762 (7,5); 1,1639 (16,0); 1,1516 (7,4); 0,9207 (10,8); 0,9099 (10,6); 0,8801 (10,2); 0,8693 (10,2); - 0,0002 (0,6)

I.040: $^1\text{H-NMR}$ (600,4 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,6621 (1,7); 8,6487 (1,8); 4,4278 (1,3); 4,4144 (2,3); 4,4036 (1,4); 3,3874 (2,5); 3,3830 (4,0); 3,3682 (7,0); 3,3612 (8,8); 3,3571 (12,7); 3,3493 (18,0); 3,3414 (43,4); 3,3360 (36,0); 3,3315 (65,0); 2,8941 (0,8); 2,8706 (1,4); 2,8584 (4,6); 2,8461 (4,7); 2,8338 (1,6); 2,7348 (0,8); 2,5224 (0,3); 2,5195 (0,3); 2,5074 (16,0); 2,5046 (23,0); 2,5019 (18,8); 2,2746 (0,8); 2,2633 (1,4); 2,2522 (1,4); 2,2410 (0,9); 1,2383 (0,3); 1,1838 (4,8); 1,1821 (4,0); 1,1715 (9,9); 1,1699 (8,1); 1,1592 (4,8); 1,1577 (4,0); 0,9666 (8,0); 0,9553 (16,0); 0,9441 (8,4)

I.041: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,8963 (0,8); 8,8849 (1,5); 8,8735 (0,7); 7,3224 (0,8); 7,3190 (0,7); 7,3066 (4,7); 7,3020 (5,1); 7,2957 (16,0); 7,2888 (0,8); 7,2850 (1,0); 7,2588 (1,0); 7,2535 (1,1); 7,2471 (0,8); 7,2451 (0,9); 7,2416 (1,1); 7,2378 (0,7); 7,2341 (0,5); 7,2302 (0,5); 4,2471 (4,5); 4,2354 (4,3); 4,1396 (11,4); 3,3138 (7,8); 2,5087 (2,4); 2,5052 (4,4); 2,5016 (5,7); 2,4980 (4,0); 2,4946 (1,8)

I.042: $^1\text{H-NMR}$ (600,4 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,9670 (2,3); 8,9572 (4,7); 8,9474 (2,3); 7,9531 (0,4); 7,4900 (1,3); 7,4835 (14,7); 7,4786 (14,8); 7,4726 (14,7); 7,4685 (4,1); 7,4661 (2,0); 7,4583 (0,4); 7,4557 (0,4); 7,4278 (1,1); 7,4252 (1,6); 7,4211 (8,9); 7,4186 (5,3); 7,4169 (8,4); 7,4135 (5,3); 7,4111 (8,1); 7,4074 (3,5); 7,4051 (5,6); 7,3991 (0,5); 4,3480 (15,8); 4,3381 (16,0); 3,9727 (0,8); 3,9631 (0,8); 3,3589 (87,2); 2,9801 (0,9); 2,8945 (3,4); 2,8861 (0,8); 2,7362 (2,7); 2,6190 (0,4); 2,5278 (0,7); 2,5248 (0,8); 2,5217 (0,8); 2,5130 (17,6); 2,5100 (39,4); 2,5069 (55,5); 2,5039 (39,7); 2,5008 (18,1); 2,3907 (0,4); 1,2374 (0,7); -0,0002 (0,7)

I.043: $^1\text{H-NMR}$ (600,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,6215 (3,2); 8,6084 (3,2); 4,8247 (1,3); 4,8123 (2,3); 4,8034 (1,8); 4,7999 (1,8); 4,7910 (2,3); 4,7785 (1,3); 3,4767 (1,5); 3,4676 (1,8); 3,4578 (2,9); 3,4488 (3,0); 3,4382 (2,5); 3,4292 (2,1); 3,3544 (2,8); 3,3441 (3,1); 3,3425 (3,0); 3,3373 (2,4); 3,3361 (2,4); 3,3241 (16,0); 2,5139 (4,1); 2,5108 (8,4); 2,5079 (12,1); 2,5049 (9,1); 2,5020 (4,2); 2,4981 (3,0); 2,4964 (2,9); 2,4870 (2,5); 2,4774 (1,5); 2,4761 (1,4); 2,3815 (1,0); 2,3698 (1,2); 2,3611 (2,5); 2,3492 (2,6); 2,3405 (2,3); 2,3286 (2,3); 2,3201 (0,9); 2,3083 (0,7); 1,0621 (0,4)

I.044: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,4935 (1,7); 3,5990 (16,0); 3,3260 (7,7); 2,6406 (6,6); 2,5125 (6,4); 2,5081 (12,9); 2,5036 (16,9); 2,4990 (12,5); 2,4945 (6,3); 0,8822 (0,5); 0,8595 (2,4); 0,8526 (2,1); 0,8322 (2,1); 0,8297 (2,0); 0,8244 (2,4); 0,8019 (0,5); -0,0002 (4,4)

I.045: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,2213 (0,7); 8,2071 (1,2); 8,1930 (0,6); 4,1143 (2,3); 4,0966 (7,5); 4,0789 (7,6); 4,0611 (2,5); 3,7074 (0,4); 3,5479 (5,5); 3,5332 (5,5); 3,3324 (44,7); 2,5263 (0,4); 2,5216 (0,6); 2,5130 (8,9); 2,5085 (18,2); 2,5039 (24,2); 2,4992 (17,4); 2,4947 (8,2); 1,2009 (7,8); 1,1832 (16,0); 1,1655 (7,6); 1,1235 (1,5); 1,1121 (3,8); 1,1048 (5,2); 1,0960 (2,2); 1,0584 (0,3); 1,0457 (0,4); 1,0084 (2,5); 0,9994 (5,4); 0,9921 (3,9); 0,9805 (1,6); -0,0002 (0,3)

I.046: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,7450 (2,0); 8,7253 (2,0); 7,5449 (1,5); 7,0622 (1,6); 4,8115 (0,8); 4,7983 (1,7); 4,7920 (0,9); 4,7845 (0,9); 4,7786 (1,7); 4,7649 (0,8); 4,1419 (1,6); 4,1244 (5,3); 4,1068 (5,6); 4,0891 (1,9); 3,3338 (47,2); 2,7804 (0,7); 2,7662 (0,7); 2,7403 (2,4); 2,7341 (0,6); 2,7326 (0,6); 2,7262 (2,3); 2,7146 (2,4); 2,7015 (2,5); 2,6744 (0,9); 2,6616 (0,7); 2,5266 (0,3); 2,5219 (0,5); 2,5133 (7,7); 2,5088 (15,9); 2,5042 (21,1); 2,4996 (15,2); 2,4950 (7,2); 1,1977 (7,6); 1,1800 (16,0); 1,1623 (7,3); -0,0002 (0,5)

I.047: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,2226 (3,0); 4,1431 (2,2); 4,1253 (7,1); 4,1076 (7,2); 4,0899 (2,2); 3,3341 (50,4); 2,8933 (0,4); 2,5270 (0,4); 2,5223 (0,6); 2,5137 (9,1); 2,5091 (19,0); 2,5045 (25,3); 2,4999 (18,3); 2,4953 (8,7); 1,2344 (7,6); 1,2167 (15,7); 1,1989 (7,3); 1,0468 (1,5); 1,0382 (16,0); 0,9504 (1,3); 0,9362 (3,4); 0,9315 (3,8); 0,9185 (1,8); 0,7879 (1,8); 0,7746 (3,6); 0,7701 (3,6); 0,7557 (1,3); -0,0002 (0,4)

I.048: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,9198 (1,4); 8,9004 (1,4); 4,8111 (0,5); 4,7999 (0,6); 4,7898 (1,0); 4,7790 (0,9); 4,7693 (0,6); 4,7578 (0,5); 4,1879 (1,2); 4,1857 (1,3); 4,1702 (3,9); 4,1680 (4,0); 4,1523 (4,1); 4,1504 (4,0); 4,1344 (1,4); 4,1330 (1,3); 3,3356 (64,5); 2,9947 (0,5); 2,9842 (0,5); 2,9669 (1,2); 2,9570 (1,4); 2,9390 (1,2); 2,9352 (1,2); 2,9303 (1,4); 2,9081 (1,0); 2,5265 (0,5); 2,5218 (0,7); 2,5131 (10,3); 2,5086 (21,2); 2,5040 (28,1); 2,4993 (20,3); 2,4948 (9,6); 1,2395 (0,4); 1,2196 (7,6); 1,2019 (16,0); 1,1841 (7,3); -0,0002 (0,5)

I.049: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8266 (1,8); 3,6363 (16,0); 3,6150 (0,8); 3,3928 (0,3); 3,3507 (7,1); 3,1110 (15,4); 2,5605 (5,5); 2,5331 (1,0); 2,5272 (1,9); 2,5212 (2,4); 2,5151 (1,6); 2,5092 (0,7); 2,4130 (0,7); 1,3989 (1,1); 1,3822 (2,7); 1,3719 (2,8); 1,3571 (1,2); 1,1238 (1,4); 1,1091 (2,8); 1,0988 (2,6); 1,0818 (0,9); 0,9244 (0,3)

I.050: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 10,7542 (3,5); 10,7499 (3,6); 8,7859 (5,2); 8,7801 (5,3); 8,5975 (4,9); 3,3512 (16,0); 2,5614 (1,1); 2,5341 (1,6); 2,5281 (3,4); 2,5221 (4,7); 2,5160 (3,4); 2,5102 (1,6); 1,3757 (2,0); 1,3601 (5,0); 1,3492 (5,5); 1,3353 (2,3); 1,0273 (2,4); 1,0133 (5,4); 1,0024 (5,1); 0,9868 (1,9); 0,0183 (1,6)

I.051: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 12,9877 (0,4); 8,5819 (1,2); 8,5565 (1,2); 4,5511 (0,4); 4,5238 (0,8); 4,5061 (0,7); 4,4973 (0,6); 4,4798 (0,4); 3,3544 (3,2); 2,5982 (0,8); 2,5780 (1,2); 2,5728 (1,1); 2,5589 (1,6); 2,5333 (2,4); 2,5277 (3,3); 2,5218 (4,1); 2,5158 (3,2); 2,1334 (0,6); 2,1072 (1,0); 2,0948 (1,4); 2,0917 (1,5); 2,0705 (16,0); 2,0459 (0,6); 0,0184 (2,8)

I.052: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4663 (3,3); 7,2984 (18,8); 4,5313 (3,5); 3,2822 (16,0); 1,6318 (3,6); 1,6175 (12,3); 1,6137 (10,7); 1,6049 (9,0); 1,5869 (4,6); 1,5321 (0,5); 1,4096 (0,4); 1,3543 (4,0); 1,3364 (7,8); 1,3286 (8,1); 1,3093 (3,1); 1,2894 (1,5); 1,2587 (0,4); 0,0459 (0,7); 0,0351 (19,9); 0,0243 (0,8)

I.053: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7532 (10,7); 8,6779 (2,5); 8,6593 (5,1); 8,6407 (2,5); 5,7765 (0,9); 4,1409 (16,0); 4,1221 (15,9); 3,3535 (9,4); 2,5343 (2,6); 2,5283 (5,7); 2,5222 (7,8); 2,5161 (5,7); 2,5102 (2,6); 1,4470 (4,3); 1,4312 (10,7); 1,4200 (12,1); 1,4060 (5,2); 1,3532 (0,4); 1,1844 (0,4); 1,1310 (5,4); 1,1170 (11,8); 1,1057 (11,0); 1,0899 (4,2); 0,0186 (5,7)

I.054: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 11,2747 (3,6); 8,4125 (1,9); 4,1853 (0,4); 3,8477 (4,7); 3,8293 (4,6); 3,6754 (1,0); 3,6203 (16,0); 3,3525 (11,9); 2,5339 (1,3); 2,5280 (2,8); 2,5220 (3,7); 2,5160 (2,7); 2,5101 (1,3); 0,0159 (4,2)

I.055: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 9,1792 (1,4); 7,4286 (1,0); 7,2982 (5,1); 3,7915 (16,0); 1,7561 (1,0); 1,7389 (2,8); 1,7290 (2,8); 1,7125 (1,2); 1,6232 (1,2); 1,2882 (0,8); 1,2031 (1,2); 1,1868 (2,7); 1,1769 (2,8); 1,1595 (1,0); 0,0341 (5,3)

I.056: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,1119 (5,8); 8,0936 (6,2); 7,9534 (2,3); 4,4672 (2,2); 4,4576 (5,1); 4,4483 (4,6); 4,4393 (5,3); 4,4294 (2,7); 3,8714 (3,3); 3,8609 (3,5); 3,8436 (7,0); 3,8333 (6,5); 3,7974 (6,2); 3,7880 (6,7); 3,7697 (3,6); 3,7603 (3,4); 2,8932 (16,0); 2,7509 (0,4); 2,7449 (0,4); 2,7346 (13,1); 2,7335 (13,5); 2,5490 (4,4); 2,5276 (0,6); 2,5228 (1,1); 2,5141 (18,7); 2,5097 (39,0); 2,5052 (51,8); 2,5006 (38,0); 2,4961 (19,0); 2,3800 (0,7); 2,3319 (0,4); 1,2383 (0,8); 0,0079 (1,2); -0,0002 (33,7); -0,0085 (1,2)

I.057: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,3709 (1,2); 4,2052 (0,7); 4,1874 (1,9); 4,1697 (1,9); 4,1520 (0,6); 4,0531 (0,7); 4,0301 (0,6); 3,3261 (7,6); 2,8919 (0,5); 2,7323 (0,4); 2,5204 (0,4); 2,5118 (4,9); 2,5074 (9,9); 2,5028 (13,0); 2,4982 (9,6); 2,4937 (4,7); 1,3961 (16,0); 1,2112 (2,0); 1,1935 (4,2); 1,1757 (1,9); -0,0002 (3,6)

I.058: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,5937 (1,7); 8,5755 (1,8); 4,4901 (0,8); 4,4767 (1,1); 4,4702 (1,4); 4,4579 (1,4); 4,4512 (1,0); 4,4377 (0,8); 4,1595 (1,2); 4,1567 (1,4); 4,1513 (0,4); 4,1418 (3,9); 4,1390 (4,1); 4,1239 (4,1); 4,1213 (4,1); 4,1118 (0,4); 4,1060 (1,4); 4,1037 (1,3); 3,3262 (27,0); 2,5254 (0,8); 2,5206 (1,3); 2,5120 (15,1); 2,5076 (30,4); 2,5030 (40,0); 2,4984 (29,6); 2,4939 (14,6); 1,8125 (0,5); 1,7950 (0,7); 1,7920 (0,6); 1,7767 (1,2); 1,7595 (1,3); 1,7571 (1,3); 1,7394 (1,0); 1,7086 (1,0); 1,6949 (1,2); 1,6908 (1,2); 1,6769 (1,2); 1,6597 (0,6); 1,6554 (0,6); 1,6420 (0,5); 1,2394 (0,3); 1,2215 (7,7); 1,2038 (16,0); 1,1860 (7,4); 0,8193 (0,3); 0,8069 (0,7); 0,8004 (0,6); 0,7885 (1,1); 0,7764 (0,7); 0,7697 (0,7); 0,7570 (0,4); 0,4580 (0,9); 0,4501 (1,2); 0,4439 (2,7); 0,4380 (1,9); 0,4298 (1,7); 0,4239 (2,7); 0,4187 (1,4); 0,4101 (0,8); 0,1898 (0,4); 0,1783 (0,8); 0,1705 (0,8); 0,1665 (0,6); 0,1591 (1,2); 0,1555 (1,1); 0,1472 (1,0); 0,1432 (0,9); 0,0917 (0,9); 0,0876 (1,0); 0,0796 (1,1); 0,0760 (1,2); 0,0687 (0,6); 0,0647 (0,8); 0,0566 (0,8); 0,0447 (0,3); 0,0079 (0,3); -0,0002 (11,0); -0,0085 (0,4)

I.059: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,4245 (1,7); 8,4059 (1,7); 4,7138 (0,9); 4,7038 (1,3); 4,7005 (1,3); 4,6952 (1,1); 4,6904 (1,2); 4,6852 (1,3); 4,6819 (1,2); 4,6717 (0,9); 4,1943 (0,5); 4,1851 (1,0); 4,1760 (1,5); 4,1673 (3,2); 4,1580 (3,4); 4,1495 (3,4); 4,1403 (3,2); 4,1315 (1,5); 4,1226 (1,0); 4,1133 (0,6); 3,8085 (1,5); 3,7949 (1,5); 3,7833 (2,6); 3,7697 (2,4); 3,7188 (2,4); 3,7088 (2,6); 3,6936 (1,6); 3,6837 (1,4); 3,3275 (17,2); 3,2904 (31,3); 2,5255 (0,7); 2,5206 (1,2); 2,5120 (13,6); 2,5076 (27,0); 2,5031 (35,1); 2,4985 (25,8); 2,4941 (12,7); 1,2387 (0,9); 1,2217 (7,8); 1,2040 (16,0); 1,1862 (7,5); -0,0002 (4,8)

I.060: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,6644 (6,7); 7,4404 (2,3); 7,1284 (2,4); 3,3661 (16,0); 2,5337 (2,8); 2,5278 (5,8); 2,5218 (7,8); 2,5158 (5,6); 2,5102 (2,6); 2,0948 (0,7); 1,3686 (3,1); 1,3534 (7,8); 1,3424 (8,6); 1,3287 (3,5); 1,0270 (3,8); 1,0133 (8,6); 1,0023 (7,9); 0,9870 (2,9); 0,0187 (2,6)

I.061: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,3632 (1,0); 8,3526 (1,8); 8,3422 (1,0); 4,2897 (3,5); 4,2792 (3,6); 3,7934 (16,0); 3,3735 (25,2); 3,1999 (14,7); 2,5694 (2,6); 2,5659 (5,7); 2,5623 (8,0); 2,5587 (6,0); 2,5551 (3,0)

I.062: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7899 (2,3); 8,7790 (4,3); 8,7681 (2,4); 8,5233 (2,4); 8,5121 (4,5); 8,5008 (2,5); 4,2390 (15,7); 4,2278 (16,0); 4,0233 (14,1); 4,0117 (14,4); 3,3758 (6,2); 2,9530 (1,0); 2,7936 (0,9); 2,5672 (9,9); 2,5636 (13,7); 2,5601 (10,7)

I.063: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,4134 (1,1); 8,4036 (1,6); 8,3937 (0,9); 4,7452 (0,9); 4,5093 (9,6); 4,3134 (7,2); 4,3029 (7,2); 3,3747 (5,8); 3,1615 (16,0); 2,9952 (1,4); 2,9531 (1,7); 2,7937 (1,4); 2,5706 (2,6); 2,5672 (5,3); 2,5636 (7,3); 2,5601 (5,4); 2,5568 (2,7)

I.064: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 8,1891 (1,5); 8,1675 (1,5); 7,4903 (2,1); 7,4830 (2,5); 7,4639 (4,9); 7,4628 (4,9); 7,4586 (5,7); 7,4500 (1,3); 7,4446 (1,9); 7,4371 (1,8); 7,4347 (1,8); 7,4295 (1,4); 7,4166 (5,7); 7,3910 (6,0); 7,3839 (2,3); 7,3701 (1,5); 7,3530 (0,4); 7,3459 (0,4); 7,2979 (0,6); 5,7318 (4,3); 5,7096 (4,2); 4,3646 (0,4); 4,3408 (1,2); 4,3288 (0,9); 4,3169 (1,2); 4,3050 (2,7); 4,2932 (0,5); 4,2810 (3,4); 4,2564 (3,4); 4,2441 (0,5); 4,2324 (2,7); 4,2203 (1,2); 4,2088 (0,9); 4,1966 (1,2); 4,1729 (0,4); 1,2934 (8,1); 1,2696 (16,0); 1,2458 (7,7); 0,0404 (0,6)

I.065: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, CDCl_3):

δ = 8,2355 (1,1); 7,2711 (1,2); 4,2429 (4,8); 4,2355 (5,0); 3,0492 (14,1); 3,0355 (16,0); 1,2551 (0,3); -0,0002 (1,4)

I.066: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,2868 (2,1); 8,2733 (4,2); 8,2598 (2,2); 7,5063 (3,8); 7,1851 (3,8); 3,8762 (16,0); 3,8625 (16,0); 3,3400 (89,8); 3,3165 (0,5); 2,5136 (6,0); 2,5091 (12,6); 2,5046 (17,2); 2,5001 (12,2); 2,4956 (5,6); 2,0777 (1,4); -0,0001 (2,8)

I.067: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6789 (1,1); 7,6622 (1,1); 7,2614 (7,3); 4,9155 (0,6); 4,8990 (1,5); 4,8847 (1,5); 4,8681 (0,7); 3,8155 (15,5); 2,6119 (0,4); 2,5959 (1,1); 2,5785 (2,5); 2,5590 (2,6); 2,5428 (1,3); 2,5298 (0,4); 2,3258 (0,5); 2,3085 (0,9); 2,2933 (1,0); 2,2775 (0,8); 2,2580 (0,4); 2,1919 (0,4); 2,1758 (1,0); 2,1560 (1,2); 2,1397 (1,0); 2,1087 (16,0); 1,5547 (5,7); -0,0002 (10,4)

I.068: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7256 (0,9); 8,7069 (0,9); 4,6042 (0,4); 4,5893 (0,5); 4,5845 (0,8); 4,5699 (0,7); 4,5652 (0,6); 4,5503 (0,4); 3,6798 (13,0); 3,3256 (6,7); 2,5868 (0,8); 2,5702 (1,0); 2,5628 (0,7); 2,5524 (0,7); 2,5432 (1,3); 2,5243 (0,8); 2,5130 (3,4); 2,5088 (6,8); 2,5042 (8,6); 2,4996 (6,2); 2,4952 (3,0); 2,1059 (0,6); 2,0875 (1,3); 2,0833 (1,0); 2,0731 (0,9); 2,0672 (1,1); 2,0541 (16,0); 1,2377 (0,4); -0,0002 (3,8)

I.069: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7247 (0,8); 8,7061 (0,8); 4,6045 (0,3); 4,5896 (0,5); 4,5848 (0,7); 4,5703 (0,6); 4,5656 (0,5); 4,5506 (0,4); 3,6799 (12,7); 3,3251 (4,9); 2,5869 (0,7); 2,5705 (0,9); 2,5629 (0,7); 2,5525 (0,7); 2,5433 (1,3); 2,5244 (0,8); 2,5132 (3,1); 2,5089 (6,2); 2,5043 (7,8); 2,4997 (5,5); 2,4951 (2,6); 2,1063 (0,6); 2,0878 (1,2); 2,0834 (0,9); 2,0734 (0,9); 2,0672 (1,0); 2,0617 (0,9); 2,0542 (16,0); -0,0002 (5,1)

I.070: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7384 (3,5); 4,1072 (2,3); 4,0894 (7,4); 4,0717 (7,5); 4,0540 (2,4); 3,3827 (83,4); 3,3775 (122,0); 2,5121 (24,8); 2,5077 (31,1); 2,5033 (22,9); 2,1276 (1,5); 2,1162 (1,4); 2,1083 (1,6); 2,0947 (2,5); 2,0777 (1,2); 2,0443 (1,3); 2,0308 (2,7); 2,0226 (2,0); 1,9995 (1,6); 1,9867 (0,9); 1,7677 (0,4); 1,7212 (5,4); 1,7134 (4,6); 1,2396 (0,4); 1,1733 (7,9); 1,1556 (16,0); 1,1378 (7,5); -0,0002 (0,4)

I.071: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8381 (2,2); 3,7671 (0,7); 3,7579 (1,4); 3,7487 (0,9); 3,7380 (1,2); 3,7285 (2,2); 3,7197 (1,2); 3,6419 (16,0); 3,6245 (1,5); 3,6135 (1,5); 3,6044 (0,8); 3,5956 (0,9); 3,5828 (0,7); 3,3417 (10,0); 3,3391 (9,9); 3,3324 (15,6); 2,8944 (1,1); 2,7352 (1,0); 2,5089 (12,4); 2,5047 (15,7); 2,5005 (12,0); 2,0214 (0,3); 1,9996 (3,2); 1,9897 (4,5); 1,9795 (3,1); 1,9684 (1,6); -0,0002 (0,4)

I.072: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8797 (2,5); 3,6524 (16,0); 3,3397 (22,9); 2,5093 (14,4); 2,5051 (17,9); 2,5010 (13,3); 2,2749 (1,2); 2,2528 (1,5); 2,0610 (1,6); 2,0447 (2,0); 2,0285 (1,2); 2,0090 (1,5); 1,9894 (2,6); 1,9625 (1,9); 1,9391 (0,3); -0,0002 (0,4)

I.073: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,3792 (0,8); 8,3611 (1,5); 8,3432 (0,8); 7,9747 (1,0); 7,9604 (1,0); 3,9039 (4,9); 3,8854 (4,8); 3,3504 (16,0); 2,6390 (10,2); 2,6237 (10,1); 2,5345 (1,5); 2,5285 (3,2); 2,5225 (4,4); 2,5164 (3,2); 2,5105 (1,5); 0,0189 (2,0)

I.074: ^1H -NMR(400,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 12,4581 (0,4); 12,4448 (0,4); 8,4595 (1,8); 8,4408 (1,9); 8,4249 (2,0); 8,4047 (1,9); 7,2584 (1,1); 7,2409 (2,9); 7,2375 (3,0); 7,2235 (5,6); 7,2108 (7,7); 7,1942 (3,4); 4,7831 (0,6); 4,7660 (1,3); 4,7495 (1,3); 4,7327 (0,6); 4,5003 (0,6); 4,4805 (1,3); 4,4661 (1,2); 4,4471 (0,6); 4,0871 (0,4); 3,5964 (16,0); 3,3150 (23,3); 3,1716 (2,1); 3,0592 (0,8); 3,0453 (0,9); 3,0243 (1,8); 3,0107 (1,6); 2,9814 (1,6); 2,9594 (1,6); 2,9470 (0,9); 2,9251 (0,8); 2,8903 (0,6); 2,7571 (0,4); 2,7291 (2,9); 2,7210 (3,0); 2,7044 (2,2); 2,6799 (0,4); 2,6624 (0,4); 2,5009 (18,8); 2,4544 (0,4); -0,0002 (2,2)

I.075: ^1H -NMR(400,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7647 (0,5); 7,9581 (0,3); 4,4990 (0,5); 4,4855 (0,8); 4,4765 (0,9); 4,4679 (0,8); 4,4584 (0,7); 4,4448 (0,5); 3,6735 (16,0); 3,4859 (0,7); 3,3279 (934,4); 2,8968 (2,1); 2,7376 (2,0); 2,5110 (41,2); 2,5071 (53,1); 2,3702 (1,6); 2,3521 (3,7); 2,3338 (2,4); 2,1305 (0,5); 2,1154 (0,7); 2,0963 (0,9); 2,0829 (0,8); 2,0767 (0,6); 2,0635 (0,4); 2,0145 (0,4); 1,9976 (0,7); 1,9744 (0,8); 1,9623 (0,6); 1,9569 (0,7); 1,9395 (0,5); 1,9135 (0,9); 1,0414 (0,4); 1,0134 (0,4); 1,0036 (0,4); 0,9889 (0,4); 0,9787 (0,4)

I.076: ^1H -NMR(300,2 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2993 (1,9); 7,1987 (1,3); 3,9789 (0,7); 3,9650 (1,5); 3,9510 (0,8); 3,9384 (1,1); 3,9246 (2,1); 3,9107 (1,1); 3,8023 (16,0); 3,7733 (1,2); 3,7648 (1,3); 3,7311 (1,9); 3,6986 (0,9); 3,6900 (0,9); 2,3929 (0,8); 2,3782 (0,8); 2,3583 (0,8); 2,3450 (1,6); 2,3313 (1,1); 2,3115 (1,1); 2,2968 (1,0); 2,1100 (1,7); 2,0635 (1,2); 2,0437 (0,8); 0,0333 (2,2)

I.077: $^1\text{H-NMR}$ (600,4 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8433 (4,2); 8,2931 (1,7); 8,2921 (1,0); 8,2907 (0,5); 4,1231 (2,4); 4,1113 (7,7); 4,0995 (7,9); 4,0877 (2,5); 3,7617 (1,3); 3,7553 (2,5); 3,7490 (1,5); 3,7421 (1,9); 3,7356 (3,6); 3,7295 (1,7); 3,6330 (1,5); 3,6252 (1,5); 3,6183 (1,8); 3,6109 (2,2); 3,6051 (1,2); 3,5991 (1,4); 3,5908 (1,2); 3,4392 (5,4); 3,4125 (22,9); 3,4010 (33,5); 3,3956 (64,6); 3,3898 (119,2); 3,3869 (184,6); 3,3639 (1,0); 2,8959 (0,9); 2,7366 (0,8); 2,5292 (0,4); 2,5261 (0,5); 2,5230 (0,5); 2,5144 (9,7); 2,5113 (22,2); 2,5083 (31,4); 2,5052 (22,6); 2,5021 (10,2); 2,0064 (0,4); 1,9918 (5,2); 1,9851 (7,2); 1,9780 (4,8); 1,9705 (2,6); 1,9546 (0,4); 1,9474 (0,4); 1,2388 (0,4); 1,1801 (7,7); 1,1682 (16,0); 1,1564 (7,7)

I.078: $^1\text{H-NMR}$ (600,4 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,2126 (1,6); 8,2002 (1,6); 5,2636 (0,8); 5,2608 (1,1); 5,2537 (1,6); 5,2514 (2,1); 5,2447 (0,9); 5,2418 (1,0); 4,5516 (0,9); 4,5447 (1,8); 4,5382 (1,4); 4,5322 (1,8); 4,5251 (0,9); 4,1687 (2,3); 4,1569 (7,4); 4,1451 (7,6); 4,1333 (2,4); 3,8668 (0,7); 3,8591 (0,8); 3,8568 (0,8); 3,8483 (1,7); 3,8404 (1,4); 3,8381 (1,5); 3,8305 (1,2); 3,8021 (1,3); 3,7954 (1,5); 3,7932 (1,5); 3,7865 (1,5); 3,7834 (1,0); 3,7768 (0,9); 3,7745 (0,9); 3,7679 (0,8); 3,3301 (22,2); 3,3265 (17,8); 3,3227 (21,6); 3,3208 (30,9); 2,8941 (0,5); 2,7354 (0,4); 2,5220 (0,4); 2,5189 (0,3); 2,5102 (7,2); 2,5071 (16,0); 2,5041 (22,8); 2,5010 (16,1); 2,4979 (7,3); 1,2249 (7,9); 1,2130 (16,0); 1,2012 (7,7); -0,0002 (0,5)

I.079: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,4472 (3,2); 4,8737 (5,9); 4,8564 (7,0); 4,6949 (6,8); 4,6776 (5,9); 4,2288 (2,3); 4,2111 (7,3); 4,1933 (7,4); 4,1756 (2,3); 4,0217 (0,4); 3,4317 (0,4); 3,4062 (0,3); 3,3328 (37,6); 2,5261 (0,4); 2,5213 (0,5); 2,5127 (8,0); 2,5081 (16,4); 2,5036 (21,8); 2,4989 (15,7); 2,4944 (7,4); 1,2302 (7,8); 1,2125 (16,0); 1,1948 (7,4); -0,0002 (0,5)

I.080: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,4758 (1,6); 3,7047 (16,0); 3,6843 (3,5); 3,6660 (1,2); 3,6578 (4,3); 3,4868 (4,1); 3,4604 (3,2); 3,3321 (26,0); 2,8925 (0,8); 2,7335 (0,7); 2,7323 (0,7); 2,5213 (0,4); 2,5127 (5,0); 2,5082 (10,3); 2,5036 (13,6); 2,4989 (9,8); 2,4944 (4,7)

I.081: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 12,6780 (0,4); 8,6905 (1,3); 8,6746 (1,3); 4,9329 (0,5); 4,9204 (0,9); 4,9173 (0,6); 4,9087 (0,7); 4,9049 (0,9); 4,8931 (0,5); 3,7262 (16,0); 3,7083 (0,6); 2,9755 (0,7); 2,9644 (0,7); 2,9475 (0,5); 2,9415 (1,7); 2,9305 (1,5); 2,9021 (1,6); 2,8892 (1,6); 2,8682 (0,7); 2,8553 (0,7); 2,5663 (0,3); 2,5627 (0,7); 2,5591 (1,0); 2,5554 (0,7); 2,5518 (0,3)

I.082: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7668 (1,4); 8,7527 (1,4); 7,3599 (1,0); 6,8434 (1,0); 4,4508 (0,5); 4,4410 (0,6); 4,4365 (0,7); 4,4325 (0,8); 4,4269 (0,7); 4,4228 (0,7); 4,4184 (0,7); 4,4085 (0,5); 3,6715 (16,0); 3,6544 (0,4); 3,4097 (1,3); 3,3222 (2,3); 3,0665 (1,3); 2,5094 (1,3); 2,5059 (1,7); 2,5023 (1,3); 2,4991 (0,6); 2,2304 (1,4); 2,2158 (3,5); 2,2015 (2,1); 2,1129 (0,3); 2,1087 (0,4); 2,0952 (0,6); 2,0806 (0,7); 2,0705 (0,6); 2,0653 (0,3); 1,9785 (0,6); 1,9744 (0,4); 1,9643 (0,6); 1,9603 (0,7); 1,9505 (0,5); 1,9462 (0,6); 1,9323 (0,4)

I.083: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,9453 (2,4); 7,9326 (2,4); 7,2604 (12,0); 4,8085 (3,2); 4,8006 (3,2); 4,7925 (3,2); 4,3327 (2,7); 4,3149 (7,8); 4,2972 (7,9); 4,2795 (2,8); 4,0830 (6,5); 2,2527 (2,7); 1,5554 (7,0); 1,4313 (0,4); 1,3507 (8,2); 1,3330 (16,0); 1,3153 (8,1); -0,0002 (16,4)

I.084: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7048 (1,5); 8,6887 (1,6); 4,5670 (0,5); 4,5502 (1,3); 4,5339 (1,3); 4,5178 (0,5); 4,1614 (1,0); 4,1505 (2,0); 4,1452 (2,2); 4,1337 (2,2); 4,1285 (2,1); 4,1180 (1,1); 3,3125 (4,4); 2,6032 (0,4); 2,5869 (1,1); 2,5696 (2,4); 2,5504 (2,5); 2,5312 (1,1); 2,5023 (2,7); 2,0999 (1,2); 2,0817 (2,6); 2,0560 (16,0); 1,2222 (3,7); 1,2045 (7,5); 1,1870 (3,8); -0,0002 (1,4)

I.085: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,7554 (4,4); 7,2600 (17,3); 4,3649 (2,6); 4,3471 (7,9); 4,3296 (8,1); 4,3124 (3,0); 3,8085 (8,9); 3,7832 (11,5); 3,6005 (11,4); 3,5754 (9,2); 1,5677 (4,3); 1,5094 (0,9); 1,3590 (8,1); 1,3415 (16,0); 1,3237 (8,4); 1,2571 (1,3); -0,0002 (21,4)

I.086: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,7182 (4,6); 7,2598 (17,5); 3,2679 (9,2); 3,2396 (16,0); 3,2107 (9,6); 2,0037 (0,4); 1,6693 (0,5); 1,5421 (19,8); 1,5136 (91,7); 1,4014 (0,3); 1,3529 (0,6); 1,2929 (0,5); 1,2552 (2,8); -0,0002 (19,4)

I.087: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,3781 (2,3); 7,2605 (7,5); 3,7618 (16,0); 2,6817 (3,9); 2,6488 (4,4); 2,1509 (4,4); 2,1184 (4,0); 2,0050 (2,9); 1,5472 (10,0); 1,2930 (14,7); 1,2570 (0,8); 1,2267 (14,9); -0,0002 (9,1)

I.088: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5959 (2,2); 7,2600 (7,5); 3,8385 (16,0); 3,4120 (0,8); 3,3807 (2,1); 3,3460 (2,5); 3,3159 (1,1); 3,1310 (1,1); 3,1093 (1,3); 3,0975 (2,0); 3,0756 (1,9); 3,0402 (0,9); 1,5431 (7,4); 1,2557 (0,8); -0,0002 (8,2)

I.089: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 12,1213 (0,8); 7,5495 (2,1); 7,5346 (2,2); 7,2688 (7,7); 4,9088 (0,6); 4,8914 (2,4); 4,8735 (3,6); 4,8555 (2,4); 4,8385 (0,7); 3,1384 (2,9); 3,1209 (9,6); 3,1060 (12,6); 3,0908 (10,3); 3,0738 (3,6); 2,9733 (2,3); 2,9550 (6,7); 2,9366 (7,0); 2,9183 (2,8); 2,8030 (0,8); 2,7849 (0,9); 2,7673 (0,3); 2,2748 (3,1); 1,6696 (5,3); 1,5777 (0,4); 1,5558 (14,7); 1,5381 (14,9); 1,4383 (17,2); 1,4202 (33,8); 1,4021 (17,6); 1,3654 (0,6); 1,3156 (1,2); 1,3019 (9,0); 1,2837 (16,0); 1,2654 (8,1); -0,0002 (10,4)

I.090: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,4518 (1,6); 7,4347 (1,6); 7,2618 (6,8); 4,8362 (2,5); 4,8274 (2,6); 4,8184 (2,5); 4,8097 (2,5); 2,9708 (0,6); 2,9571 (1,3); 2,9443 (3,6); 2,9301 (4,3); 2,9182 (3,6); 2,9038 (1,4); 2,8915 (0,6); 2,4372 (0,4); 2,4235 (1,2); 2,4141 (1,3); 2,4099 (1,6); 2,4008 (1,6); 2,3965 (1,4); 2,3871 (1,2); 2,3735 (0,5); 1,5616 (16,0); 1,2925 (0,5); 1,2838 (8,0); 1,2690 (15,7); 1,2542 (8,5); 1,0498 (14,4); 1,0361 (14,2); 0,9797 (14,4); 0,9660 (14,2); -0,0002 (7,2)

I.091: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,7169 (2,2); 7,7023 (2,3); 7,2604 (15,2); 5,9827 (1,9); 4,6255 (0,6); 4,6085 (2,4); 4,5915 (3,7); 4,5743 (2,5); 4,5581 (0,7); 2,8765 (15,7); 2,8649 (16,0); 1,5569 (12,0); 1,5171 (14,7); 1,5001 (14,9); 1,2603 (0,4); -0,0002 (21,6)

I.092: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 9,2214 (1,8); 9,2073 (1,8); 7,2624 (3,4); 5,2995 (0,6); 5,2073 (2,6); 5,1970 (3,1); 5,1881 (3,1); 5,1778 (2,9); 4,3230 (0,8); 4,3141 (1,3); 4,2968 (3,9); 4,2800 (5,2); 4,2647 (4,2); 4,2474 (1,5); 4,2384 (1,0); 2,5349 (0,5); 2,5178 (1,3); 2,5061 (1,7); 2,5007 (1,9); 2,4897 (2,0); 2,4839 (1,7); 2,4726 (1,5); 2,4557 (0,6); 1,5614 (5,2); 1,3486 (8,0); 1,3308 (16,0); 1,3130 (8,3); 1,2562 (0,5); 1,1191 (14,8); 1,1017 (14,9); 1,0309 (14,8); 1,0137 (14,9); -0,0002 (3,9)

I.093: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 9,1697 (0,9); 7,2622 (4,2); 5,3010 (2,8); 5,2224 (1,4); 5,2117 (1,6); 5,2032 (1,5); 5,1925 (1,4); 3,8140 (16,0); 2,5081 (0,7); 2,4968 (0,8); 2,4913 (1,0); 2,4799 (1,0); 2,4629 (0,7); 1,5600 (7,7); 1,1106 (7,5); 1,0933 (7,5); 1,0327 (7,5); 1,0155 (7,5); -0,0002 (4,8)

I.094: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6390 (1,8); 7,6195 (1,8); 7,2618 (6,6); 5,8864 (1,8); 4,3960 (2,2); 4,3793 (3,0); 4,3598 (2,0); 3,4129 (0,6); 3,3968 (1,2); 3,3794 (2,0); 3,3628 (2,1); 3,3460 (1,8); 3,3286 (1,7); 3,3128 (2,0); 3,2957 (1,9); 3,2788 (1,2); 3,2625 (0,6); 2,2580 (0,4); 2,2410 (1,2); 2,2243 (2,0); 2,2078 (2,1); 2,1912 (1,4); 2,1743 (0,5); 1,5949 (8,6); 1,2589 (0,5); 1,1879 (6,6); 1,1698 (12,9); 1,1518 (6,4); 1,0292 (13,6); 1,0219 (15,6); 1,0125 (16,0); 1,0057 (14,6); -0,0002 (8,7)

I.095: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 13,0983 (2,7); 10,3818 (0,4); 10,3463 (3,2); 10,3287 (3,1); 4,7992 (2,5); 4,7822 (4,2); 4,7662 (2,8); 3,3075 (79,5); 3,2610 (0,7); 3,1176 (0,4); 2,9798 (0,4); 2,9437 (0,3); 2,6670 (0,6); 2,5001 (100,3); 2,4538 (0,8); 2,4263 (0,4); 2,3825 (0,7); 2,3627 (1,7); 2,3468 (2,8); 2,3299 (3,2); 2,3157 (2,0); 2,0743 (0,3); 1,0514 (15,7); 1,0341 (16,0); 1,0153 (15,7); 0,9983 (15,2); 0,9493 (0,3); -0,0002 (42,8)

I.096: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6121 (1,6); 7,5935 (1,7); 7,2621 (7,0); 5,9692 (1,6); 4,4074 (1,9); 4,3906 (2,8); 4,3709 (1,9); 2,9573 (0,4); 2,8676 (11,8); 2,8558 (12,1); 2,8291 (0,3); 2,2740 (0,4); 2,2577 (1,1); 2,2409 (1,9); 2,2242 (1,9); 2,2075 (1,2); 2,1910 (0,4); 1,5973 (5,9); 1,0301 (11,9); 1,0187 (16,0); 1,0143 (15,3); 1,0030 (12,4); -0,0002 (8,8)

I.097: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,9990 (0,9); 3,3695 (31,8); 2,5255 (0,9); 2,5125 (8,3); 2,5081 (10,3); 2,5036 (7,6); 2,4781 (0,4); 2,3015 (0,6); 2,2804 (0,4); 2,2710 (0,6); 1,9468 (0,5); 1,9336 (0,4); 1,9254 (0,6); 1,9046 (0,3); 1,4024 (16,0)

I.098: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,1176 (7,4); 3,9311 (16,0); 3,9134 (16,0); 3,3608 (156,2); 2,6754 (0,4); 2,5975 (1,9); 2,5765 (3,6); 2,5647 (3,7); 2,5614 (3,5); 2,5507 (4,2); 2,5433 (3,4); 2,5286 (4,0); 2,5104 (49,2); 2,5060 (61,3); 2,5018 (45,2); 2,3573 (2,2); 2,3344 (4,8); 2,3141 (3,4); 2,3045 (4,2); 2,2826 (2,1); 2,0179 (0,4); 2,0046 (1,2); 1,9904 (1,9); 1,9777 (3,8); 1,9673 (3,2); 1,9569 (4,6); 1,9449 (1,8); 1,9360 (2,5); 1,9299 (1,5); 1,9154 (0,6); 1,9084 (0,5); 1,1079 (0,6); 1,1016 (0,9); 1,0894 (1,7); 1,0820 (1,6); 1,0702 (2,8); 1,0583 (1,7); 1,0514 (1,8); 1,0393 (1,0); 1,0326 (0,6); 0,5083 (2,2); 0,4974 (7,1); 0,4929 (7,5); 0,4824 (3,5); 0,4771 (7,3); 0,4729 (6,9); 0,4626 (2,5); 0,2704 (2,7); 0,2596 (8,6); 0,2564 (8,3); 0,2480 (7,5); 0,2443 (8,6); 0,2332 (2,0)

I.099: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,0901 (4,9); 4,0808 (4,7); 4,0649 (9,6); 4,0490 (4,8); 3,3413 (19,7); 3,3364 (17,7); 3,3324 (18,1); 2,5831 (1,2); 2,5620 (2,3); 2,5501 (2,5); 2,5365 (2,8); 2,5283 (2,7); 2,5072 (39,4); 2,5031 (47,7); 2,4991 (35,7); 2,3480 (1,4); 2,3251 (3,2); 2,3044 (2,3); 2,2953 (2,7); 2,2733 (1,4); 1,9964 (0,7); 1,9823 (1,3); 1,9667 (2,4); 1,9593 (2,1); 1,9455 (3,1); 1,9244 (1,6); 1,9040 (0,4); 1,8973 (0,3); 1,5712 (1,0); 1,5547 (3,2); 1,5380 (4,1); 1,5178 (3,5); 1,5019 (1,3); 1,3572 (0,7); 1,3386 (2,5); 1,3197 (4,2); 1,3009 (4,1); 1,2827 (2,3); 1,2645 (0,6); 0,8743 (8,4); 0,8558 (16,0); 0,8374 (7,1); -0,0002 (2,0); -0,0011 (2,1)

I.100: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,1591 (3,3); 7,3824 (0,4); 7,3791 (0,5); 7,3593 (2,4); 7,3569 (2,3); 7,3452 (16,0); 7,3336 (3,5); 7,3299 (2,7); 7,3239 (1,1); 7,3222 (1,1); 7,3128 (1,3); 7,3021 (0,4); 7,2983 (0,4); 5,1467 (12,2); 3,3407 (12,3); 3,3367 (14,3); 2,6201 (0,8); 2,6159 (0,6); 2,6038 (1,0); 2,5987 (1,4); 2,5871 (1,4); 2,5834 (1,4); 2,5732 (1,6); 2,5655 (1,3); 2,5512 (1,1); 2,5254 (0,6); 2,5117 (13,0); 2,5075 (24,6); 2,5031 (31,0); 2,4986 (22,2); 2,3680 (0,9); 2,3450 (1,8); 2,3249 (1,5); 2,3153 (1,7); 2,2931 (0,9); 2,0117 (0,5); 2,0023 (0,7); 1,9973 (0,8); 1,9883 (0,9); 1,9824 (1,5); 1,9744 (1,3); 1,9611 (1,9); 1,9522 (0,8); 1,9404 (1,0); -0,0002 (1,2)

I.101: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,0942 (4,0); 4,0422 (4,8); 4,0262 (10,1); 4,0102 (4,9); 3,3580 (14,2); 3,3522 (23,5); 3,3431 (35,0); 2,5903 (1,1); 2,5691 (2,0); 2,5619 (1,6); 2,5574 (2,1); 2,5539 (2,0); 2,5434 (2,4); 2,5358 (2,0); 2,5086 (31,1); 2,5042 (39,7); 2,4998 (29,4); 2,3530 (1,2); 2,3304 (2,9); 2,3099 (1,9); 2,3002 (2,4); 2,2784 (1,2); 2,0001 (0,7); 1,9908 (0,8); 1,9860 (1,1); 1,9724 (2,2); 1,9629 (1,8); 1,9518 (2,6); 1,9405 (1,0); 1,9309 (1,4); 1,9249 (0,8); 1,9102 (0,4); 1,6152 (0,5); 1,5968 (2,2); 1,5804 (4,4); 1,5621 (4,7); 1,5457 (2,3); 1,5277 (0,6); 0,8840 (8,0); 0,8656 (16,0); 0,8470 (7,2)

I.102: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,1109 (16,0); 4,9548 (1,7); 4,9369 (6,6); 4,9184 (9,9); 4,9001 (6,7); 4,8813 (1,7); 3,3400 (76,1); 3,3360 (80,5); 2,8918 (0,7); 2,7320 (0,6); 2,6767 (0,9); 2,6724 (1,2); 2,6681 (0,9); 2,5737 (4,1); 2,5576 (5,4); 2,5522 (7,6); 2,5408 (8,0); 2,5372 (7,9); 2,5263 (12,3); 2,5078 (149,6); 2,5035 (191,5); 2,4991 (142,9); 2,3352 (5,4); 2,3123 (12,0); 2,3051 (10,0); 2,2919 (12,5); 2,2846 (15,6); 2,2818 (15,7); 2,2744 (9,0); 2,2670 (10,4); 2,2611 (13,1); 2,2433 (4,8); 2,2367 (3,6); 2,0154 (2,2); 2,0080 (1,8); 1,9899 (10,1); 1,9829 (7,2); 1,9708 (10,6); 1,9654 (14,0); 1,9592 (14,6); 1,9520 (9,6); 1,9468 (9,6); 1,9386 (15,4); 1,9222 (4,0); 1,9161 (7,3); 1,8957 (1,4); 1,8892 (1,2); 1,8682 (0,4); 1,7791 (1,2); 1,7732 (2,0); 1,7680 (1,3); 1,7479 (5,3); 1,7287 (2,9); 1,7227 (5,2); 1,7034 (1,2); 1,6967 (1,8); 1,6551 (1,6); 1,6348 (3,3); 1,6296 (3,4); 1,6097 (6,5); 1,5836 (5,3); 1,5635 (2,4); 1,5583 (2,0); 1,5378 (0,8); 1,2685 (0,8); 1,2518 (0,8); 1,2370 (0,9); 1,2204 (0,7); 0,0002 (8,7)

I.103: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0934 (16,0); 7,9556 (0,7); 4,7497 (3,3); 4,7400 (4,3); 4,7302 (6,0); 4,7216 (4,7); 4,7108 (3,0); 4,7024 (1,6); 3,3479 (249,2); 2,8941 (4,3); 2,7341 (3,9); 2,6795 (0,8); 2,6752 (1,0); 2,6709 (0,7); 2,5760 (4,0); 2,5560 (7,9); 2,5427 (8,6); 2,5288 (13,1); 2,5106 (128,4); 2,5062 (160,4); 2,5018 (117,4); 2,3529 (4,7); 2,3310 (10,7); 2,3093 (7,2); 2,2997 (9,0); 2,2780 (4,3); 2,0084 (0,7); 1,9949 (3,5); 1,9802 (4,6); 1,9731 (9,4); 1,9577 (7,7); 1,9519 (10,7); 1,9446 (4,6); 1,9313 (5,9); 1,9104 (1,4); 1,9037 (0,8); 1,7376 (4,5); 1,7285 (5,1); 1,7104 (7,5); 1,6979 (6,6); 1,6895 (7,6); 1,6469 (3,9); 1,6230 (6,4); 1,6053 (6,9); 1,4472 (6,0); 1,4267 (10,3); 1,4054 (9,4); 1,3816 (10,1); 1,3591 (8,1); 1,3365 (7,0); 1,3292 (7,2); 1,3071 (7,4); 1,2886 (3,4); 1,2675 (2,5); 1,2608 (2,5); 1,2380 (1,0)

I.104: ^1H -NMR(300,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,8081 (3,6); 9,3076 (3,6); 8,5356 (2,8); 8,5173 (5,5); 8,4988 (2,8); 4,1953 (16,0); 4,1769 (15,9); 3,3318 (48,1); 2,7352 (0,6); 2,7288 (0,9); 2,5147 (62,1); 2,5089 (118,2); 2,5030 (154,5); 2,4972 (108,9); 2,2728 (0,9); 2,0763 (1,6); 1,2337 (0,3); 0,0107 (1,9); -0,0002 (45,6); -0,0113 (1,8)

I.105: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,6468 (4,9); 9,1439 (5,0); 8,7012 (13,9); 3,3353 (33,0); 3,3124 (0,8); 2,5133 (5,0); 2,5089 (10,6); 2,5044 (14,4); 2,4999 (10,4); 2,4955 (4,8); 2,0776 (15,9); 1,8546 (6,2); 1,8439 (14,9); 1,8348 (16,0); 1,8247 (6,5); 1,7853 (0,4); 1,2721 (0,4); 1,2325 (7,2); 1,2222 (15,8); 1,2131 (15,5); 1,2023 (6,1); 1,1634 (0,4); 0,0000 (3,5)

I.106: ^1H -NMR(300,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,5899 (3,0); 8,5723 (6,1); 8,5538 (3,1); 7,2465 (0,3); 7,0755 (0,4); 6,9056 (0,4); 4,1187 (0,8); 4,0985 (0,5); 4,0652 (16,0); 4,0466 (15,9); 3,9910 (0,4); 3,9710 (0,4); 3,9514 (0,4); 3,9180 (0,4); 3,8967 (0,4); 3,8815 (0,4); 3,8249 (0,5); 3,8086 (0,5); 3,7644 (0,6); 3,6762 (0,7); 3,5930 (1,1); 3,5094 (1,7); 3,3895 (2,4); 3,3099 (2,0); 3,2448 (1,5); 3,2068 (1,2); 3,1866 (1,1); 3,1688 (1,0); 3,0937 (0,6); 3,0332 (0,5); 2,9618 (0,4); 2,9421 (0,4); 2,8913 (1,6); 2,8800 (0,4); 2,7308 (1,5); 2,5420 (1,2); 2,5089 (37,0); 2,5030 (47,8); 2,4972 (33,9); 2,0756 (3,0); 1,2354 (1,2); 0,8922 (0,3); -0,0003 (8,5)

I.107: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 11,6352 (0,3); 11,6186 (0,4); 11,5615 (0,4); 11,5434 (0,5); 8,8715 (12,3); 7,2037 (0,4); 7,0759 (0,4); 6,9484 (0,4); 3,3468 (61,9); 2,6766 (0,3); 2,6718 (0,4); 2,6674 (0,3); 2,5422 (2,2); 2,5118 (23,3); 2,5074 (49,0); 2,5028 (66,9); 2,4983 (47,6); 2,4939 (22,0); 2,3295 (0,4); 2,0759 (1,0); 1,5930 (0,4); 1,5546 (5,3); 1,5423 (13,9); 1,5335 (15,2); 1,5226 (6,5); 1,4921 (0,4); 1,4835 (0,6); 1,3395 (0,7); 1,2990 (7,2); 1,2880 (16,0); 1,2792 (15,1); 1,2667 (5,6); 1,2342 (0,6); 0,8903 (0,6); 0,0000 (6,6)

I.108: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2621 (5,5); 5,0537 (0,5); 5,0353 (1,5); 5,0170 (1,5); 4,9986 (0,5); 4,2527 (0,4); 4,2436 (0,6); 4,2343 (0,6); 4,2260 (1,9); 4,2097 (2,6); 4,1928 (2,0); 4,1753 (0,6); 4,1662 (0,4); 3,7771 (16,0); 2,0083 (0,4); 1,6374 (7,5); 1,6190 (7,5); 1,5578 (6,7); 1,2855 (4,4); 1,2676 (9,0); 1,2499 (4,4); 0,8981 (0,4); 0,8820 (1,0); 0,8642 (0,5); 0,0696 (0,8); -0,0002 (7,2)

I.109: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2607 (13,9); 5,2999 (0,6); 5,0689 (0,5); 5,0511 (1,6); 5,0326 (1,6); 5,0148 (0,6); 3,7787 (15,9); 3,7560 (16,0); 1,6405 (7,5); 1,6221 (7,6); 1,5472 (12,6); 1,2546 (0,9); -0,0002 (18,1)

I.110: ^1H -NMR(600,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 4,5146 (0,1); 4,5028 (0,5); 4,4909 (0,5); 4,4790 (0,2); 4,1155 (0,2); 4,1094 (0,2); 4,1036 (0,2); 4,0975 (0,5); 4,0906 (0,2); 4,0856 (0,5); 4,0786 (0,5); 4,0737 (0,2); 4,0668 (0,5); 4,0608 (0,2); 4,0550 (0,2); 4,0489 (0,2); 3,3184 (16,0); 2,9782 (0,1); 2,9733 (0,2); 2,9668 (0,2); 2,9562 (0,1); 2,6133 (0,1); 2,5222 (0,3); 2,5192 (0,4); 2,5161 (0,4); 2,5072 (7,7); 2,5042 (15,9); 2,5012 (21,7); 2,4982 (16,0); 2,4953 (7,5); 2,3851 (0,1); 1,4939 (2,3); 1,4821 (2,2); 1,4698 (0,1); 1,4580 (0,1); 1,1865 (1,4); 1,1747 (2,8); 1,1629 (1,3); 1,1375 (0,1); 0,7318 (0,2); 0,7248 (0,2); 0,7204 (0,3); 0,7127 (0,3); 0,7094 (0,3); 0,7014 (0,2); 0,6988 (0,2); 0,6949 (0,2); 0,6908 (0,2); 0,6851 (0,2); 0,6818 (0,2); 0,6758 (0,2); 0,6683 (0,3); 0,6648 (0,2); 0,6611 (0,3); 0,6551 (0,3); 0,6516 (0,2); 0,6481 (0,2); 0,6450 (0,2); 0,6388 (0,1); 0,6357 (0,1); 0,6322 (0,1); 0,6299 (0,1)

I.111: ^1H -NMR(400,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 13,0750 (0,6); 4,9149 (0,5); 4,8968 (1,8); 4,8786 (1,9); 4,8606 (0,6); 3,7456 (16,0); 3,3290 (0,6); 2,5035 (3,7); 1,5051 (7,0); 1,4869 (7,2); -0,0002 (1,5)

I.112: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0633 (1,6); 3,6511 (16,0); 3,3401 (77,6); 2,8910 (0,9); 2,7309 (0,8); 2,5964 (0,5); 2,5913 (0,3); 2,5810 (0,6); 2,5746 (0,9); 2,5678 (0,6); 2,5635 (0,9); 2,5594 (0,8); 2,5493 (1,0); 2,5414 (0,9); 2,5260 (1,1); 2,5205 (1,1); 2,5118 (13,4); 2,5074 (27,2); 2,5028 (35,7); 2,4982 (25,9); 2,4938 (12,5); 2,3500 (0,5); 2,3300 (1,1); 2,3268 (1,2); 2,3071 (0,8); 2,2978 (0,9); 2,2752 (0,5); 1,9847 (0,5); 1,9759 (0,5); 1,9656 (0,8); 1,9613 (0,9); 1,9533 (0,4); 1,9457 (1,1); 1,9384 (0,6); 1,9238 (0,6); -0,0002 (3,2)

I.113: ^1H -NMR(400,1 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 13,0710 (0,6); 13,0627 (0,6); 10,4617 (2,4); 10,4454 (2,4); 4,9070 (0,6); 4,8891 (2,2); 4,8713 (3,4); 4,8535 (2,3); 4,8356 (0,6); 3,6015 (0,6); 3,3006 (16,5); 2,4999 (44,7); 2,4959 (37,4); 1,9872 (0,9); 1,9076 (0,7); 1,7598 (0,6); 1,5082 (16,0); 1,4901 (16,0); 1,3898 (0,4); 1,3746 (0,4); 1,3557 (0,9); 1,2347 (0,3); 1,1693 (1,1); 1,1569 (0,3); -0,0002 (17,6)

I.114: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,7157 (1,7); 8,6740 (4,7); 3,3141 (17,2); 2,9903 (15,7); 2,9795 (16,0); 2,5102 (7,4); 2,5057 (15,6); 2,5012 (21,8); 2,4967 (16,3); 2,4922 (8,4); 2,0738 (0,5); 1,8455 (3,5); 1,8347 (8,6); 1,8258 (9,4); 1,8156 (3,8); 1,2192 (3,8); 1,2088 (9,2); 1,1998 (9,1); 1,1890 (3,6); 0,0000 (5,8)

I.115: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8518 (4,4); 3,5018 (16,0); 3,3198 (75,7); 3,3007 (16,5); 2,5411 (3,0); 2,5108 (13,2); 2,5063 (28,0); 2,5017 (38,4); 2,4972 (27,3); 2,4927 (12,7); 2,0747 (1,5); 1,5214 (3,7); 1,5081 (9,2); 1,5007 (9,8); 1,4891 (4,8); 1,4483 (0,5); 1,3739 (0,4); 1,3334 (4,7); 1,3217 (9,4); 1,3145 (9,3); 1,3010 (3,4); 0,0081 (0,3); -0,0001 (9,6)

I.116: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2599 (17,8); 4,5626 (0,5); 4,2589 (2,3); 4,2409 (7,3); 4,2265 (16,0); 4,2055 (2,8); 4,1924 (0,6); 4,1735 (0,4); 4,1218 (0,8); 3,0958 (1,5); 3,0865 (1,8); 1,5431 (21,2); 1,5114 (0,3); 1,3207 (6,9); 1,3029 (13,9); 1,2850 (7,3); 1,2723 (1,2); 1,2545 (0,6); 0,8825 (0,4); 0,7561 (3,6); 0,7395 (4,6); 0,7269 (2,8); 0,7063 (2,4); 0,6955 (5,8); 0,6667 (0,9); -0,0002 (21,7)

I.117: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 9,3088 (0,6); 7,2597 (11,7); 5,2022 (1,2); 5,1848 (1,8); 5,1673 (1,2); 3,8394 (16,0); 1,6464 (7,6); 1,6287 (7,6); 1,5414 (18,3); -0,0002 (13,5)

I.118: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 9,3542 (1,3); 9,3467 (1,3); 7,2599 (14,8); 5,1943 (0,6); 5,1768 (2,4); 5,1594 (3,5); 5,1420 (2,4); 5,1246 (0,6); 4,3209 (2,5); 4,3031 (7,6); 4,2853 (7,7); 4,2674 (2,7); 3,8761 (0,5); 3,2679 (0,4); 2,7848 (0,5); 1,6426 (14,8); 1,6250 (14,9); 1,5454 (12,7); 1,4319 (0,5); 1,3513 (8,0); 1,3335 (16,0); 1,3157 (8,2); 1,2639 (0,8); 0,8818 (0,7); 0,8647 (0,3); -0,0002 (17,1)

I.119: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,7078 (2,0); 7,6931 (2,0); 7,2642 (5,9); 6,1873 (1,3); 5,6386 (1,3); 4,7230 (0,8); 4,7056 (3,0); 4,6883 (4,6); 4,6709 (3,0); 4,6535 (0,8); 3,2734 (10,5); 2,7836 (16,0); 1,6790 (9,2); 1,5523 (18,3); 1,5349 (18,1); -0,0002 (7,4)

I.120: ^1H -NMR(400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,8165 (1,7); 7,8007 (1,7); 7,2629 (5,6); 6,1225 (1,5); 4,6394 (0,6); 4,6221 (2,3); 4,6048 (3,6); 4,5875 (2,4); 4,5702 (0,6); 3,3752 (1,0); 3,3605 (3,2); 3,3574 (2,9); 3,3425 (4,7); 3,3246 (3,3); 3,3069 (1,0); 1,6172 (11,0); 1,5188 (14,5); 1,5015 (14,4); 1,1995 (8,1); 1,1814 (16,0); 1,1632 (7,9); -0,0002 (7,3)

I.121: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5059 (5,8); 7,4968 (5,9); 7,4717 (0,6); 7,3597 (3,0); 7,2651 (24,3); 4,7186 (0,4); 4,7105 (7,0); 4,6994 (7,1); 4,6932 (7,7); 4,6873 (7,9); 4,6821 (7,9); 4,6763 (7,6); 4,6701 (7,4); 4,6590 (7,1); 4,5645 (6,9); 4,5624 (7,5); 4,5461 (15,3); 4,5442 (16,0); 4,5280 (9,3); 4,5260 (9,4); 4,5081 (0,4); 4,5059 (0,4); 4,3823 (8,6); 4,3704 (9,9); 4,3636 (8,0); 4,3599 (10,0); 4,3517 (8,4); 4,3481 (10,0); 4,3412 (8,5); 4,3294 (7,6); 3,2701 (2,2); 2,9655 (4,2); 2,9632 (4,5); 2,9537 (4,7); 2,9513 (4,6); 2,9483 (4,7); 2,9459 (4,8); 2,9404 (5,2); 2,9376 (6,6); 2,9340 (4,9); 2,9285 (5,2); 2,9261 (4,9); 2,9231 (5,1); 2,9207 (5,2); 2,9112 (4,6); 2,9089 (4,4); 2,7826 (3,3); 2,3625 (4,1); 2,3447 (4,6); 2,3398 (8,0); 2,3376 (5,5); 2,3218 (8,2); 2,3197 (5,7); 2,3169 (5,9); 2,3147 (8,3); 2,2990 (5,1); 2,2968 (7,3); 2,2918 (4,8); 2,2848 (0,5); 2,2740 (3,6); 2,2690 (0,4); 2,2670 (0,4); 2,0439 (0,6); 1,6096 (4,6); 1,2589 (0,6); 1,2549 (0,4); 0,0064 (0,7); -0,0002 (26,8); -0,0068 (1,0)

I.122: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,3515 (2,0); 7,3166 (0,5); 7,3120 (0,8); 7,3077 (0,4); 7,2952 (2,5); 7,2910 (1,3); 7,2770 (2,5); 7,2675 (0,8); 7,2635 (1,4); 7,2599 (0,9); 7,2528 (0,4); 7,2462 (1,3); 7,1168 (2,0); 7,1129 (2,5); 7,0965 (2,2); 5,7587 (0,7); 3,6585 (16,0); 3,3301 (40,9); 3,3067 (1,2); 3,2733 (1,9); 3,1989 (2,0); 3,1655 (1,2); 2,6709 (0,4); 2,5244 (1,2); 2,5196 (1,8); 2,5110 (22,8); 2,5066 (45,3); 2,5020 (58,4); 2,4974 (41,6); 2,4929 (19,8); 2,3288 (0,4); 1,4429 (9,8); -0,0002 (5,6)

I.123: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,4999 (2,4); 9,4790 (2,4); 5,7585 (1,1); 5,6342 (0,4); 5,6134 (1,6); 5,5926 (2,5); 5,5719 (1,7); 5,5508 (0,4); 4,2745 (0,5); 4,2655 (1,2); 4,2578 (1,6); 4,2477 (3,6); 4,2406 (3,7); 4,2299 (3,8); 4,2229 (3,5); 4,2124 (1,6); 4,2053 (1,2); 4,1959 (0,4); 3,3306 (102,2); 2,6715 (0,8); 2,5066 (108,3); 2,5025 (132,9); 2,4986 (99,0); 2,3292 (0,8); 1,2439 (7,9); 1,2262 (16,0); 1,2084 (7,6); -0,0001 (8,4)

I.124: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,2153 (1,0); 9,1984 (1,0); 7,5594 (1,7); 7,5563 (1,8); 7,5467 (1,8); 7,5435 (1,8); 7,1968 (1,5); 7,1947 (1,1); 7,1905 (1,2); 7,1881 (1,6); 7,1858 (1,2); 7,0445 (1,9); 7,0357 (1,7); 7,0317 (1,8); 7,0229 (1,6); 5,8763 (1,8); 5,8593 (1,8); 5,7585 (0,7); 3,7131 (16,0); 3,3347 (41,2); 2,6713 (0,4); 2,5247 (1,2); 2,5201 (1,8); 2,5113 (22,0); 2,5069 (44,2); 2,5023 (57,5); 2,4977 (41,0); 2,4931 (19,6); 2,3292 (0,4); -0,0002 (2,3)

I.125: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,5005 (16,0); 8,4868 (15,9); 8,1562 (6,6); 8,1439 (9,1); 8,1400 (9,1); 8,1271 (6,3); 5,7592 (5,2); 4,5987 (7,4); 4,5849 (7,7); 4,5744 (7,9); 4,5606 (7,5); 4,0941 (0,3); 3,3682 (0,6); 3,3307 (418,5); 3,2828 (3,6); 3,2707 (3,7); 3,2529 (4,1); 3,2443 (7,5); 3,2336 (5,6); 3,2167 (5,4); 3,2048 (5,3); 3,1749 (2,0); 3,1617 (1,9); 3,1149 (4,0); 3,1004 (5,8); 3,0837 (5,0); 3,0642 (3,8); 3,0523 (2,5); 2,6809 (1,4); 2,6763 (3,1); 2,6717 (4,2); 2,6672 (3,0); 2,6629 (1,4); 2,5252 (14,1); 2,5204 (22,0); 2,5118 (273,8); 2,5073 (545,9); 2,5028 (705,0); 2,4982 (504,2); 2,4937 (241,6); 2,3826 (0,3); 2,3384 (1,5); 2,3341 (3,1); 2,3296 (4,3); 2,3250 (3,1); 2,0315 (6,8); 1,9978 (7,3); 1,9330 (5,3); 1,8989 (7,3); 1,7958 (5,4); 1,7859 (5,6); 1,7715 (3,9); 1,7599 (5,9); 1,7483 (6,8); 1,7160 (4,4); 1,7082 (6,3); 1,6999 (3,6); 1,6825 (4,5); 1,6751 (6,3); 1,6503 (2,0); 1,6419 (2,6); 1,4834 (3,2); 1,4767 (3,4); 1,4504 (8,3); 1,4226 (6,4); 1,4176 (7,2); 1,3907 (2,8); 1,3848 (2,1); 1,2787 (2,4); 1,2456 (6,2); 1,2122 (5,8); 1,1826 (2,2); 0,0080 (2,1); -0,0002 (65,1); -0,0085 (2,1)

I.126: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

$\delta =$ 8,0192 (1,1); 7,9422 (6,1); 7,8937 (0,4); 7,5192 (0,4); 7,2599 (73,3); 6,9957 (0,4); 5,7801 (6,1); 4,4452 (3,3); 4,4320 (6,0); 4,4170 (6,2); 4,4025 (6,2); 4,3895 (3,6); 3,4210 (8,8); 3,4157 (9,8); 3,4008 (16,0); 3,3869 (8,8); 3,3577 (0,7); 2,9549 (5,9); 2,8831 (5,6); 2,7794 (1,9); 2,7687 (4,5); 2,7548 (4,8); 2,7473 (3,5); 2,7367 (5,1); 2,7229 (4,9); 2,7116 (2,2); 2,0322 (3,5); 2,0118 (8,4); 2,0003 (12,0); 1,9870 (8,9); 1,9652 (2,4); 1,7059 (2,2); 1,6841 (3,1); 1,6740 (3,8); 1,6644 (2,7); 1,6538 (5,4); 1,6446 (2,9); 1,6347 (3,1); 1,6232 (3,0); 1,6029 (1,8); 1,5532 (96,4); 1,2568 (0,5); 0,1463 (0,6); 0,0690 (0,6); -0,0002 (92,8); -0,1500 (0,5)

I.127: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

$\delta =$ 7,6461 (0,9); 7,6286 (0,9); 7,2657 (1,8); 4,8303 (0,6); 4,8172 (0,9); 4,8120 (1,3); 4,7994 (1,3); 4,7940 (0,8); 4,7812 (0,6); 3,8204 (15,9); 3,0083 (0,3); 2,9931 (0,4); 2,9866 (0,4); 2,9733 (1,0); 2,9585 (1,0); 2,9522 (1,0); 2,9370 (0,9); 2,9251 (0,8); 2,9081 (1,2); 2,9042 (1,0); 2,8876 (1,0); 2,8736 (0,5); 2,8696 (0,5); 2,8527 (0,4); 2,3323 (16,0); 2,3179 (0,8); 2,3042 (0,6); 2,3012 (0,6); 2,2954 (0,5); 2,2821 (0,8); 2,2662 (0,9); 2,2603 (0,6); 2,2525 (0,6); 2,2474 (0,6); 2,2311 (0,4); 2,1465 (0,4); 2,1282 (0,7); 2,1109 (0,9); 2,0919 (0,8); 2,0753 (0,5); 1,6021 (3,7); -0,0002 (2,0)

I.128: $^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 9,9659 (1,7); 8,5690 (1,7); 8,5505 (3,2); 8,5322 (1,6); 4,2817 (8,0); 4,2629 (7,9); 3,3276 (9,5); 3,0104 (16,0); 2,9953 (15,6); 2,5081 (19,8); 2,5023 (25,0); 2,4966 (17,4); 2,0760 (0,9); 1,2338 (1,2); 1,1988 (0,5); 1,1745 (0,8); 1,1500 (0,5); -0,0004 (19,0); -0,0114 (0,7)

I.129: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,8018 (3,5); 8,7911 (6,4); 8,7796 (3,5); 4,3709 (16,0); 4,3597 (15,8); 3,6090 (0,4); 3,5266 (0,5); 3,4368 (63,8); 3,3535 (89,8); 3,3281 (79,6); 3,2600 (0,4); 3,1758 (0,5); 2,6761 (0,5); 2,6715 (0,6); 2,5417 (0,8); 2,5113 (36,3); 2,5069 (73,9); 2,5024 (99,2); 2,4979 (70,4); 2,4934 (32,7); 2,3292 (0,6); 2,3246 (0,5); 2,0764 (2,4); 1,2343 (1,9); 0,8537 (0,5); 0,0082 (2,3); 0,0000 (57,3); -0,0083 (2,1)

I.130: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2600 (21,1); 7,1924 (1,0); 7,1727 (1,0); 4,9686 (2,1); 4,9540 (2,3); 4,9470 (2,2); 4,9324 (2,1); 2,2420 (0,3); 2,2253 (1,0); 2,2087 (1,6); 2,1931 (1,6); 2,1764 (1,1); 2,1595 (0,4); 1,5425 (26,4); 1,1856 (11,8); 1,1717 (16,0); 1,1692 (15,2); 1,1551 (11,8); -0,0002 (27,3)

I.131: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,5204 (1,8); 7,3510 (4,9); 7,3325 (12,6); 7,3141 (12,2); 7,2621 (291,9); 7,1888 (2,5); 7,1734 (1,3); 7,0503 (7,9); 6,9985 (1,7); 3,6036 (1,1); 3,5841 (1,2); 3,5594 (1,3); 3,5440 (1,3); 3,5156 (1,3); 3,4851 (1,2); 3,3861 (1,1); 2,8209 (7,2); 2,7891 (7,3); 2,7591 (1,1); 2,7505 (1,1); 2,6360 (2,6); 2,6244 (3,2); 2,6104 (2,8); 2,5275 (1,6); 2,5092 (1,6); 2,5037 (1,4); 2,4418 (1,1); 2,3515 (1,1); 2,0602 (9,9); 2,0424 (16,0); 2,0124 (14,9); 1,9779 (3,2); 1,9087 (1,2); 1,8301 (4,7); 1,8183 (4,1); 1,8009 (6,3); 1,7877 (5,5); 1,7589 (2,9); 1,7147 (1,3); 1,5571 (234,3); 1,4834 (2,8); 1,4648 (1,8); 1,4585 (1,6); 1,4274 (1,5); 1,3849 (1,8); 1,3589 (2,1); 1,2902 (1,4); 1,2531 (3,4); 1,2280 (1,9); 1,2068 (1,0); 0,1462 (2,3); -0,0002 (368,6); -0,0513 (2,6); -0,1495 (2,3); -0,2075 (1,1)

I.132: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2630 (1,7); 6,9984 (0,8); 1,8345 (16,0); 1,7947 (2,6); 1,7809 (0,4); 1,4526 (2,4); -0,0002 (1,7)

I.133: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2614 (40,3); 6,9969 (0,5); 6,9464 (11,8); 3,0768 (8,2); 3,0463 (15,2); 3,0130 (10,5); 2,9574 (0,4); 2,8120 (11,2); 2,7932 (8,6); 2,7793 (14,1); 2,7561 (13,3); 2,7145 (9,8); 2,1790 (8,3); 2,1728 (8,8); 2,1460 (16,0); 2,1187 (8,2); 2,1138 (7,8); 1,5511 (39,9); 1,2629 (0,5); 1,2541 (0,6); 0,1457 (0,3); -0,0002 (56,4)

I.134: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $d_6\text{-DMSO}$):

δ = 17,5208 (0,3); 13,3089 (0,3); 8,9306 (0,4); 8,8963 (0,4); 8,8616 (0,5); 8,8451 (0,6); 8,8128 (13,0); 6,5244 (0,6); 4,8124 (0,4); 3,4932 (0,4); 3,4113 (0,4); 3,4014 (0,6); 3,3901 (0,5); 3,3659 (1,0); 3,3575 (0,8); 3,3173 (388,8); 3,2804 (3,6); 3,0266 (0,4); 3,0142 (0,4); 2,8907 (1,0); 2,7459 (0,3); 2,7307 (0,8); 2,6681 (0,9); 2,5009 (158,0); 2,4970 (126,8); 2,4487 (10,4); 2,3282 (1,0); 2,2202 (0,5); 2,1802 (0,4); 1,8099 (6,9); 1,7782 (8,2); 1,6891 (16,0); 1,6648 (9,7); 1,6150 (7,8); 1,5861 (10,7); 1,5515 (5,4); 1,4965 (0,7); 1,4524 (0,6); 1,4329 (0,4); 1,3589 (0,3); 1,3089 (2,4); 1,2796 (6,2); 1,2466 (8,1); 1,2125 (7,3); 1,1753 (10,3); 1,1439 (11,8); 1,1150 (9,0); 1,0836 (5,8); 1,0517 (1,6); 0,9973 (3,6); 0,9677 (6,9); 0,9429 (5,8); 0,9181 (2,5); 0,8181 (0,3); 0,7368 (0,4); 0,5634 (0,4); -0,0002 (29,0); -0,0405 (0,4); -0,0619 (0,4); -2,9238 (0,3)

I.135: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,6987 (0,5); 7,6833 (0,5); 7,2755 (0,7); 4,5499 (0,5); 4,5463 (0,5); 4,5429 (0,4); 4,5399 (0,4); 4,5363 (0,7); 4,5332 (0,7); 4,5294 (0,4); 4,5263 (0,4); 4,5230 (0,5); 4,5197 (0,6); 3,7257 (16,0); 2,7075 (0,6); 2,6970 (0,6); 2,6752 (1,8); 2,6648 (1,8); 2,6453 (2,2); 2,6359 (2,2); 2,6131 (0,8); 2,6037 (0,7); 1,7182 (0,7); 1,3634 (7,4); 1,3498 (7,4); -0,0002 (0,8)

I.136: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6197 (0,6); 8,6065 (0,6); 4,8628 (0,3); 4,8518 (0,3); 4,8501 (0,3); 3,6752 (5,9); 3,3905 (2,7); 3,3873 (2,8); 3,3845 (3,0); 3,3828 (3,1); 3,3803 (3,2); 3,3701 (5,3); 3,3684 (5,1); 3,3640 (5,0); 3,3622 (6,7); 3,3588 (8,9); 3,3565 (11,1); 2,8766 (0,3); 2,8588 (0,6); 2,8493 (0,5); 2,8016 (0,6); 2,7899 (0,6); 2,7743 (0,3); 2,7627 (0,3); 2,5120 (1,7); 2,5090 (3,8); 2,5059 (5,4); 2,5029 (3,9); 2,4998 (1,7); 1,3911 (16,0)

I.137: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6675 (2,4); 8,6551 (2,5); 4,4629 (0,7); 4,4542 (0,9); 4,4505 (1,0); 4,4476 (1,2); 4,4419 (1,0); 4,4390 (1,1); 4,4351 (1,0); 4,4263 (0,8); 4,1572 (0,4); 4,1510 (0,9); 4,1467 (1,2); 4,1454 (1,1); 4,1391 (3,1); 4,1349 (3,5); 4,1273 (3,4); 4,1260 (2,3); 4,1231 (3,4); 4,1154 (1,3); 4,1113 (1,1); 4,1051 (0,4); 4,0696 (2,1); 4,0577 (6,6); 4,0459 (6,7); 4,0340 (2,1); 3,3918 (11,9); 3,3860 (13,0); 3,3827 (12,8); 3,3797 (13,4); 3,3787 (13,4); 3,3705 (13,7); 3,3690 (13,7); 3,3668 (15,0); 3,3634 (19,4); 3,3609 (15,8); 3,3592 (15,6); 3,3547 (28,6); 3,3521 (20,6); 3,3493 (27,4); 3,3467 (36,7); 2,8930 (0,4); 2,7333 (0,3); 2,5262 (0,3); 2,5231 (0,4); 2,5200 (0,4); 2,5113 (8,2); 2,5082 (18,4); 2,5052 (25,9); 2,5021 (18,4); 2,4991 (8,1); 2,4450 (1,4); 2,4398 (1,5); 2,4322 (3,1); 2,4295 (2,8); 2,4271 (2,5); 2,4192 (1,7); 2,4160 (2,0); 2,1628 (0,4); 2,1540 (0,5); 2,1498 (0,8); 2,1404 (1,1); 2,1265 (1,3); 2,1177 (1,1); 2,1137 (0,6); 2,1049 (0,5); 2,0319 (0,5); 2,0191 (0,8); 2,0081 (0,9); 2,0059 (1,0); 1,9928 (0,9); 1,9823 (0,6); 1,2124 (7,4); 1,2112 (4,9); 1,2005 (15,7); 1,1993 (9,8); 1,1887 (7,3); 1,1875 (4,8); 1,1828 (7,8); 1,1814 (4,7); 1,1709 (16,0); 1,1695 (9,4); 1,1591 (7,4); 1,1576 (4,5)

I.138: $^1\text{H-NMR}$ (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6718 (1,9); 8,6588 (1,9); 4,8667 (0,6); 4,8555 (1,4); 4,8438 (1,4); 4,8328 (0,6); 4,1513 (1,6); 4,1396 (4,9); 4,1280 (5,0); 4,1162 (1,7); 4,1074 (1,6); 4,0956 (4,8); 4,0838 (4,8); 4,0722 (1,6); 3,3703 (7,6); 3,3647 (9,1); 3,3603 (7,9); 3,3577 (7,6); 3,3555 (7,0); 3,3515 (8,0); 3,3470 (15,8); 3,3418 (8,9); 3,3393 (9,5); 3,3382 (9,1); 3,3363 (12,0); 3,3341 (11,6); 3,3323 (17,6); 2,9716 (1,2); 2,9618 (1,2); 2,9440 (2,2); 2,9343 (2,1); 2,8927 (0,4); 2,8882 (2,1); 2,8769 (2,2); 2,8607 (1,2); 2,8494 (1,2); 2,5106 (6,1); 2,5076 (13,5); 2,5045 (18,9); 2,5015 (13,4); 2,4985 (6,0); 1,1943 (6,8); 1,1927 (4,8); 1,1913 (7,7); 1,1824 (14,3); 1,1809 (9,6); 1,1794 (16,0); 1,1706 (6,8); 1,1691 (4,8); 1,1676 (7,5); -0,0001 (0,5)

I.139: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,6908 (1,1); 8,6722 (1,1); 4,4995 (0,4); 4,4866 (0,6); 4,4807 (0,6); 4,4763 (0,7); 4,4679 (0,6); 4,4635 (0,6); 4,4576 (0,6); 4,4446 (0,4); 3,6699 (15,3); 3,5898 (16,0); 3,3313 (13,8); 2,5128 (4,8); 2,5085 (9,5); 2,5039 (12,4); 2,4994 (9,0); 2,4950 (4,4); 2,4668 (1,2); 2,4488 (3,0); 2,4297 (1,8); 2,1700 (0,4); 2,1566 (0,6); 2,1411 (0,4); 2,1350 (0,7); 2,1220 (0,6); 2,0371 (0,5); 2,0314 (0,4); 2,0188 (0,5); 2,0142 (0,6); 2,0020 (0,4); 1,9956 (0,5); 1,9787 (0,3); -0,0002 (1,3)

I.140: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 10,0880 (0,9); 10,0771 (0,8); 8,7126 (1,4); 8,6929 (1,4); 7,9537 (0,9); 4,7905 (0,5); 4,7790 (0,6); 4,7706 (0,7); 4,7671 (0,8); 4,7592 (0,8); 4,7556 (0,7); 4,7473 (0,6); 4,7357 (0,5); 3,9931 (1,0); 3,9815 (1,1); 3,9580 (1,2); 3,9464 (1,1); 3,7043 (2,0); 3,6958 (16,0); 3,6830 (1,3); 3,6127 (1,1); 3,5889 (1,1); 3,5775 (1,0); 3,5538 (0,9); 3,3329 (6,6); 3,0237 (7,8); 3,0125 (7,7); 2,9174 (0,7); 2,9046 (0,7); 2,8921 (6,1); 2,7332 (5,1); 2,7320 (5,3); 2,5264 (0,4); 2,5128 (7,0); 2,5085 (14,0); 2,5040 (18,3); 2,4994 (13,3); 2,4950 (6,5); -0,0002 (2,2)

I.141: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,5693 (1,2); 8,5505 (1,2); 8,3038 (0,6); 8,2906 (1,1); 8,2775 (0,6); 4,6587 (0,5); 4,6474 (0,6); 4,6380 (0,8); 4,6279 (0,8); 4,6186 (0,6); 4,6071 (0,5); 3,6823 (16,0); 3,4707 (0,8); 3,4593 (0,9); 3,4353 (1,2); 3,4240 (1,0); 3,3300 (9,2); 3,2512 (1,0); 3,2295 (1,0); 3,2158 (0,8); 3,1941 (0,7); 3,1456 (0,4); 3,1310 (1,2); 3,1133 (1,8); 3,0957 (1,2); 3,0807 (0,4); 2,8921 (2,2); 2,7322 (1,9); 2,5127 (5,8); 2,5084 (11,5); 2,5039 (15,0); 2,4994 (11,0); 2,4950 (5,4); 1,0227 (3,2); 1,0046 (6,3); 0,9866 (3,0); -0,0002 (2,2)

I.142: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,6425 (1,2); 8,6237 (1,2); 4,6620 (0,5); 4,6506 (0,6); 4,6401 (0,8); 4,6314 (0,8); 4,6210 (0,6); 4,6096 (0,5); 3,6865 (16,0); 3,5029 (1,0); 3,4914 (1,1); 3,4677 (1,4); 3,4563 (1,3); 3,3299 (7,2); 3,2952 (1,2); 3,2729 (1,2); 3,2600 (1,0); 3,2377 (0,9); 2,9258 (10,4); 2,8925 (0,6); 2,7333 (0,4); 2,5128 (5,4); 2,5085 (10,7); 2,5040 (13,8); 2,4994 (9,9); 2,4950 (4,8); -0,0002 (1,5)

I.143: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,6319 (1,0); 8,6128 (1,0); 4,6838 (0,4); 4,6710 (0,5); 4,6633 (0,8); 4,6511 (0,8); 4,6440 (0,6); 4,6311 (0,4); 4,1811 (0,8); 4,1645 (2,4); 4,1634 (2,5); 4,1468 (2,6); 4,1460 (2,6); 4,1289 (0,9); 3,3700 (32,7); 3,3658 (40,7); 3,0523 (0,5); 3,0394 (0,6); 3,0175 (1,5); 3,0047 (1,4); 2,9885 (1,4); 2,9675 (1,4); 2,9536 (0,5); 2,9327 (0,5); 2,5151 (4,3); 2,5108 (8,8); 2,5062 (11,6); 2,5016 (8,4); 2,4972 (4,1); 2,0964 (16,0); 1,2307 (4,0); 1,2129 (8,3); 1,1952 (3,8)

I.144: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,7112 (2,5); 8,6924 (2,3); 4,8897 (2,4); 4,8734 (2,2); 3,6709 (16,0); 3,6275 (16,0); 3,5723 (0,3); 3,3593 (80,2); 3,0176 (1,2); 3,0029 (1,2); 2,9759 (2,6); 2,9619 (2,2); 2,9157 (2,4); 2,8987 (2,2); 2,8743 (1,3); 2,8571 (1,0); 2,5078 (25,0)

I.145: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta =$ 8,5309 (1,3); 8,5112 (1,3); 4,5308 (0,6); 4,5177 (0,7); 4,5104 (1,2); 4,4976 (1,2); 4,4903 (0,8); 4,4773 (0,6); 4,1462 (0,8); 4,1435 (0,9); 4,1378 (0,3); 4,1284 (2,7); 4,1258 (2,7); 4,1106 (2,9); 4,1082 (2,6); 4,0986 (0,4); 4,0927 (1,0); 3,6112 (1,1); 3,5981 (1,1); 3,5769 (1,4); 3,5639 (1,3); 3,3548 (1,8); 3,3364 (15,5); 3,3206 (1,7); 3,2997 (1,1); 2,8935 (0,8); 2,7342 (0,7); 2,7330 (0,6); 2,5139 (6,3); 2,5097 (12,2); 2,5052 (15,4); 2,5007 (11,3); 2,4965 (5,7); 1,8542 (16,0); 1,2110 (4,8); 1,1933 (10,1); 1,1755 (4,7); -0,0002 (2,0)

I.146: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,2630 (3,2); 4,5664 (12,7); 4,2894 (2,3); 4,2751 (7,1); 4,2608 (7,2); 4,2465 (2,4); 2,0078 (0,4); 1,3319 (8,1); 1,3176 (16,0); 1,3033 (8,0); -0,0002 (3,6)

I.147: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 7,9278 (3,1); 7,9108 (3,1); 7,6374 (3,4); 7,2801 (3,4); 4,3713 (2,8); 4,3600 (3,1); 4,3543 (3,0); 4,3430 (2,8); 3,3215 (14,8); 2,5114 (1,4); 2,5080 (2,8); 2,5045 (3,9); 2,5009 (2,8); 2,4976 (1,4); 2,1414 (0,5); 2,1279 (1,3); 2,1145 (2,0); 2,1023 (2,0); 2,0890 (1,4); 2,0755 (0,5); 0,9339 (15,4); 0,9203 (15,1); 0,9043 (16,0); 0,8906 (15,5)

I.148: $^1\text{H-NMR}$ (500,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 10,6352 (1,0); 8,8867 (1,3); 8,3668 (0,6); 3,8314 (1,6); 3,8200 (1,6); 3,3269 (16,0); 2,5420 (0,5); 2,5099 (1,1); 2,5063 (2,3); 2,5027 (3,2); 2,4991 (2,3); 2,4956 (1,0)

I.149: $^1\text{H-NMR}$ (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,3846 (0,4); 8,3742 (0,7); 8,3662 (0,6); 3,9630 (1,4); 3,9516 (1,3); 3,7716 (1,5); 3,7597 (1,4); 3,3134 (1,9); 2,5062 (1,4); 2,5027 (1,8); 2,4993 (1,3); 1,4101 (16,0)

I.150: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, CDCl_3):

δ = 7,7220 (2,0); 7,2656 (1,2); 5,1604 (0,5); 5,1449 (1,2); 5,1294 (1,6); 5,1139 (1,2); 5,0985 (0,5); 2,7647 (0,7); 2,7380 (1,9); 2,7116 (2,8); 2,6883 (1,4); 2,6540 (1,2); 2,6360 (2,6); 2,6196 (2,1); 2,6062 (1,6); 2,5878 (0,8); 2,1625 (0,7); 2,1426 (2,1); 2,1223 (3,0); 2,1022 (1,9); 2,0823 (0,6); 1,6018 (0,9); 1,3119 (15,7); 1,2964 (16,0); -0,0002 (1,5)

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, C, D và E 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 F, G, H, I và J 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 K, L, M, N và O được mô tả sau đây thể hiện kết quả so sánh hoạt tính *in vivo in planta* của các hợp chất so sánh CMP1, CMP2, CMP3, CMP4, CMP5 và CMP6 được điều chế theo mô tả của EP0450355 và của hợp chất theo sáng chế.

Việc so sánh hoạt tính của CMP1, CMP2, CMP3, CMP4, CMP5 và CMP6 với các hợp chất theo sáng chế thể hiện rằng các hợp chất trong tình trạng kỹ thuật của sáng chế rõ ràng hoạt động kém hơn và vì thế không tạo ra hiệu quả kỹ thuật có lợi của 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 trên 2 ở nồng độ hợp chất là 300 ppm: I.001 ; I.003 ; I.006 ; I.007 ; I.008 ; I.009 ; I.010 ; I.011 ; I.012 ; I.013 ; I.015 ; I.016 ; I.017 ; I.018 ; I.019 ; I.020 ; I.021 ; I.023 ; I.025 ; I.026 ; I.029 ; I.031 ; I.032 ; I.033 ; I.034 ; I.035 ; I.036 ; I.037 ; I.038 ; I.039 ; I.040 ; I.041 ; I.042 ; I.043 ; I.044 ; I.045 ; I.046 ; I.048 ; I.049 ; I.050 ; I.051 ; I.052 ; I.054 ; I.055 ; I.056 ; I.057 ; I.058 ; I.059 ; I.061 ; I.062 ; I.064 ; I.065 ; I.066 ; I.067 ; I.068 ; I.069 ; I.072 ; I.073 ; I.074 ; I.075 ; I.076 ; I.078 ; I.079 ; I.080 ; I.089 ; I.090 ; I.091 ; I.092 ; I.093 ; I.094 ; I.095 ; I.097 ; I.098 ; I.099 ; I.100 ; I.101 ; I.102 ; I.103 ; I.104 ; I.105 ; I.106 ; I.107 ; I.108 ; I.109 ; I.111 ; I.112 ; I.113 ; I.114 ; I.115 ; I.116 ; I.117 ; I.118 ; I.119 ; I.120 ; I.121 ; I.123 ; I.124 ; I.125 ; I.126 ; I.127 ; I.128 ; I.129 ; I.130 ; I.133 ; I.134 ; I.136 ; I.137 ; I.138 ; I.139 ; I.140 ; I.141 ; I.142 ; I.143 ; I.144 ; I.145 ; I.146 ; I.148 ; I.149.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện giá trị phát huỳnh quang tương đối ít nhất là trên 2 ở nồng độ hợp chất là 75 ppm: I.001 ; I.003 ; I.007 ; I.008 ; I.009 ; I.011 ; I.012 ; I.015 ; I.016 ; I.017 ; I.018 ; I.019 ; I.020 ; I.021 ; I.022 ; I.023 ; I.025 ; I.029 ; I.036 ; I.037 ; I.040 ; I.041 ; I.042 ; I.043 ; I.046 ; I.048 ; I.051 ; I.052 ; I.054 ; I.056 ; I.058 ; I.059 ; I.061 ; I.066 ; I.067 ; I.068 ; I.069 ; I.075 ; I.076 ; I.078 ; I.079 ; I.080 ; I.089 ; I.090 ; I.092 ; I.093 ; I.098 ; I.099 ; I.100 ; I.101 ; I.102 ; I.103 ; I.104 ; I.106 ; I.107 ; I.108 ; I.109 ; I.112 ; I.113 ; I.115 ; I.117 ; I.118 ; I.119 ; I.120 ; I.121 ; I.123 ; I.124 ; I.127 ; I.128 ; I.131 ; I.136 ; I.137 ; I.138 ; I.139 ; I.140 ; I.141 ; I.142 ; I.143 ; I.144 ; I.145 ; I.146 ; I.148 ; I.149.

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 nhiều loại mầm bệnh.

Ví dụ B: Thử nghiệm tế bào *Alternaria alternata in vitro*

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: Huyền phù bào tử

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

Huyền phù bào tử của *A. alternata* 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 5 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.001; I.002; I.004; I.005; I.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.014; I.015; I.016; I.018; I.022; I.023; I.026; I.027; I.028; I.030; I.031; I.032; I.033; I.034; I.035; I.038; I.039; I.040; I.041; I.044; I.046; I.047; I.048; I.049; I.050; I.051; I.052; I.053; I.054; I.055; I.056; I.058; I.060; I.062; I.063; I.064; I.066; I.067; I.068; I.069; I.070; I.071; I.072; I.073; I.074; I.075; I.076; I.077; I.078; I.079; I.080; I.112; I.113; I.114; I.115; I.119; I.121; I.122; I.123; I.126; I.127; I.128; I.130; I.134; I.136; I.137; I.138; I.139; I.142; I.143; I.144; I.145; I.147; I.148; I.149.

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

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: Huyền phù bào tử

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

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

Các chất diệt nấm được đánh giá 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.001; I.002; I.003; I.004; I.005; I.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.012; I.014; I.015; I.016; I.018; I.022; I.026; I.027; I.028; I.030; I.035; I.038; I.039; I.041;

I.044; I.046; I.047; I.048; I.049; I.050; I.051; I.052; I.053; I.054; I.055; I.056; I.057; I.058; I.060; I.061; I.062; I.063; I.064; I.066; I.067; I.068; I.069; I.073; I.074; I.075; I.113; I.114; I.115; I.119; I.121; I.122; I.123; I.125; I.128; I.129; I.134; I.135; I.137; I.139; I.141; I.143; I.147; I.148; I.149.

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

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: Huyền phù vi khuẩn

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

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

Các hợp chất được đánh giá về khả năng của chúng trong việc ức chế sự phát triển của vi khuẩn trong thử nghiệm nuôi cấy lỏng. Các hợp chất được bổ sung với nồng độ mong muốn vào môi trường nuôi cấy chứa huyền phù vi khuẩn. Sau khi ủ trong 24 giờ, hiệu lực của hợp chất được xác định bằng cách đo phổ sinh trưởng của vi khuẩn. Khả năng ức chế được xác định bằng cách so sánh các giá trị độ hấp thụ 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.001; I.002; I.003; I.004; I.005; I.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.012; I.013; I.014; I.015; I.016; I.018; I.019; I.020; I.021; I.022; I.023; I.025; I.026; I.027; I.028; I.029; I.030; I.031; I.032; I.033; I.034; I.035; I.036; I.037; I.038; I.039; I.040; I.041; I.042; I.043; I.044; I.046; I.047; I.048; I.049; I.050; I.051; I.052; I.053; I.054; I.055; I.056; I.057; I.058; I.059; I.060; I.061; I.062; I.063; I.064; I.065; I.066; I.067; I.068; I.069; I.070; I.071; I.072; I.073; I.074; I.075; I.076; I.077; I.078; I.079; I.080; I.112; I.113; I.114; I.115; I.119; I.121; I.122; I.123; I.124; I.125; I.126; I.127; I.128;

I.129; I.130; I.134; I.135; I.136; I.137; I.138; I.139; I.140; I.141; I.142; I.143; I.144; I.145; I.146; I.147; I.149.

Ví dụ E: Thử nghiệm *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* in vitro

Dung môi: DMSO

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

Chủng cấy: Huyền phù vi khuẩn

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

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

Các hợp chất được đánh giá về khả năng của chúng trong việc ức chế sự phát triển của vi khuẩn trong thử nghiệm nuôi cấy lỏng. Các hợp chất được bổ sung với nồng độ mong muốn vào môi trường nuôi cấy chứa huyền phù vi khuẩn. Sau khi ủ trong 24 giờ, hiệu lực của hợp chất được xác định bằng cách đo phổ sinh trưởng của vi khuẩn. Khả năng ức chế được xác định bằng cách so sánh các giá trị độ hấp thụ 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.001; I.002; I.003; I.004; I.005; I.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.012; I.013; I.014; I.015; I.016; I.018; I.019; I.020; I.021; I.022; I.023; I.025; I.026; I.027; I.028; I.029; I.030; I.031; I.032; I.033; I.034; I.035; I.036; I.038; I.039; I.040; I.041; I.042; I.043; I.044; I.045; I.046; I.047; I.048; I.049; I.050; I.051; I.052; I.053; I.054; I.055; I.056; I.057; I.058; I.059; I.060; I.061; I.062; I.063; I.064; I.065; I.066; I.067; I.068; I.069; I.070; I.071; I.072; I.073; I.074; I.075; I.076; I.077; I.078; I.079; I.080; I.112; I.113; I.114; I.115; I.119; I.121; I.122; I.123; I.124; I.125; I.126; I.127; I.128; I.129; I.130; I.134; I.135; I.136; I.137; I.138; I.139; I.140; I.141; I.142; I.143; I.144; I.145; I.146; I.147; I.148; I.149.

Ví dụ F: 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*. Thực vật đậu đã gây nhiễm được ủ trong 24 giờ ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 100% và sau đó, trong 5 ngày ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 90%.

Thử nghiệm được đánh giá 6 ngày sau khi ủ. 0% nghĩa là hiệu lực tương ứng với hiệu lực của thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh xuất hiện.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.091; I.095; I.111; I.116.

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.013; I.020; I.023; I.026; I.039; I.048; I.064; I.104; I.14.

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.009; I.010; I.012; I.016; I.019; I.022; I.025; I.029; I.031; I.036; I.037; I.038; I.040; I.041; I.042; I.045; I.046; I.059; I.070; I.078; I.079; I.080; I.089; I.090; I.108; I.109; I.113; I.117; I.118; I.119; I.120; I.128.

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.006; I.010; I.022; I.041; I.059; I.061; I.062; I.066; I.117; I.119; I.120; I.127; I.139; I.143.

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.004; I.016; I.046; I.123; I.137; I.142; I.144.

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.025; I.031; I.036; I.038; I.043; I.121; I.124.

Ví dụ G: 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 xuất hiện.

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.076; I.110.

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.041; I.072; I.077; I.093.

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.008; I.009; I.010; I.011; I.012; I.013; I.016; I.020; I.022; I.023; I.025; I.029; I.031; I.036; I.037; I.038; I.039; I.040; I.042; I.043; I.046; I.048; I.059; I.064; I.078; I.079; I.080; I.089; I.090; I.091;

I.094; I.095; I.104; I.108; I.109; I.111; I.113; I.116; I.117; I.118; I.120; I.128; I.129; I.147.

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.012; I.028; I.095; I.122.

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.013; I.025; I.041; I.059; I.063; I.064; I.065; I.113.

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.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.015; I.016; I.018; I.022; I.023; I.029; I.031; I.034; I.036; I.037; I.038; I.040; I.042; I.043; I.046; I.048; I.054; I.061; I.062; I.066; I.067; I.069; I.073; I.074; I.078; I.079; I.080; I.089; I.090; I.091; I.104; I.108; I.109; I.117; I.118; I.119; I.120; I.121; I.123; I.124; I.125; I.126; I.127; I.128; I.136; I.137; I.138; I.139; I.140; I.142; I.143; I.144; I.145; I.146.

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.059.

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.025; I.041; I.049; I.050; I.057; I.069; I.073; I.111.

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.006; I.007; I.008; I.009; I.010; I.011; I.012; I.015; I.016; I.018; I.020; I.022; I.023; I.029; I.031; I.034; I.036; I.037; I.038; I.039; I.040; I.042; I.043; I.046; I.048; I.052; I.054; I.061; I.062; I.063; I.064; I.065; I.066; I.067; I.074; I.078; I.079; I.080; I.089; I.090; I.091; I.095; I.104; I.108; I.109; I.113; I.117; I.118; I.119; I.120; I.121; I.122; I.123; I.124; I.125; I.126; I.127; I.128; I.129; I.136; I.137; I.138; I.139; I.140; I.142; I.143; I.144; I.145; I.146; I.147.

Ví dụ H: 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 dung dịch 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 xuất hiện.

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.010; I.025; I.029; I.055; I.069; I.090; I.110; I.128; I.129; I.138.

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.008; I.012; I.018; I.019; I.031; I.038; I.074; I.080; I.113; I.120; I.126; I.136; I.137; I.142; I.144.

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.009; I.015; I.016; I.042; I.043; I.046; I.059; I.108; I.140; I.143; I.145.

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.018; I.064; I.109; I.110; I.111; I.125; I.136.

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.013; I.029; I.038; I.079; I.080; I.096; I.129; I.143.

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.009; I.019; I.042; I.043; I.046; I.048; I.142; I.145.

Ví dụ I: Thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Uromyces appendiculatus* (bệnh gỉ sét ở 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*. Thực vật đậu đã gây nhiễm được ủ trong 24 giờ ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 100% và sau đó, trong 9 ngày ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 70 -80%.

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

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.077; I.091.

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.010; I.023; I.041; I.072; I.129.

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.008; I.009; I.012; I.013; I.016; I.019; I.020; I.022; I.026; I.029; I.031; I.036; I.037; I.038; I.039; I.040; I.042; I.043; I.045; I.046; I.048; I.059; I.064; I.078; I.079; I.080; I.089; I.090; I.093; I.094; I.095; I.104; I.108; I.109; I.110; I.111; I.113; I.116; I.117; I.118; I.119; I.120; I.128; I.147.

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.008; I.013; I.037; I.052; I.104; I.110; I.130

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.015; I.019; I.026; I.039; I.041; I.063; I.074; I.090; I.091; I.093; I.095; I.125; I.129.

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.006; I.007; I.009; I.016; I.018; I.023; I.029; I.031; I.032; I.034; I.036; I.040; I.042; I.043; I.045; I.046; I.048; I.049; I.050; I.054; I.059; I.061; I.062; I.065; I.066; I.067; I.078; I.079; I.080; I.089; I.108; I.109; I.111; I.113; I.116; I.117; I.118; I.119; I.120; I.121; I.123; I.124; I.126; I.127; I.128; I.137; I.138; I.139; I.140; I.142; I.143; I.144; I.145; I.146; I.147.

Ví dụ J: Thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (bệnh đốm vi khuẩn ở cà chua)

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 cà chua 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 *Pseudomonas syringae* pv. *tomato*. Các cây cà chua đã gây nhiễm được ủ trong 4 ngày trong khí quyển bão hòa ở nhiệt độ ban ngày 22°C / ban đêm 20°C - độ ẩm tương đối 70% và sau đó trong 1 hoặc 2 ngày ở nhiệt độ ban ngày 22°C / ban đêm 20°C ở độ ẩm tương đối 70-80%.

Thử nghiệm được đánh giá 5 đến 6 ngày sau khi ủ. 0% nghĩa là hiệu lực tương ứng với hiệu lực của thực vật đối chứng trong khi hiệu lực 100% nghĩa là không quan sát thấy bệnh xuất hiện.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 70% đến 79% ở nồng độ 500 ppm thành phần hoạt tính: I.008; I.038; I.040; I.042; I.048.

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.025; I.093; I.094; I.095; I.104; I.108; I.109; I.111; I.117; I.128.

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.009; I.016; I.019; I.020; I.022; I.036; I.059; I.089; I.090; I.118; I.119.

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.016; I.055; I.104; I.119; I.140; I.142.

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.006; I.007; I.015; I.065; I.066; I.117; I.121; I.124; I.139; I.144; I.145.

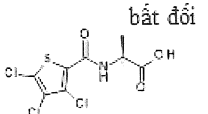
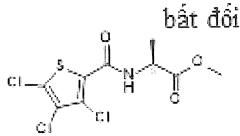
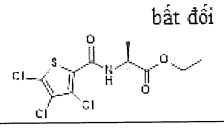
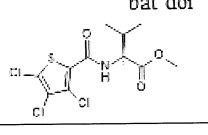
Trong thử nghiệm này, các hợp chất sau đây theo sáng chế thể hiện hiệu lực từ 90% đến 100% ở nồng độ 31 ppm thành phần hoạt tính: I.018; I.049; I.054; I.061; I.062; I.089; I.090; I.138; I.143.

Ví dụ K: Các ví dụ so sánh

Các hợp chất CMP1, CMP2, CMP3 và CMP4 được thử nghiệm trong thử nghiệm *ngăn ngừa in vivo* trên *Xanthomonas campestris pv. campestris* (bệnh thối đen trên cây cải bắp) trong cùng điều kiện như mô tả trong ví dụ H.

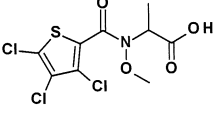
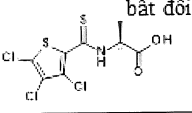
Các hợp chất CMP1, CMP2, CMP3 và CMP4 được điều chế theo hướng dẫn trong EP0450355.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 125 ppm	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP1		0	38
CMP2		*	38
CMP3		*	0
CMP4		0	0

* Không đo lường được hiệu lực do hơn 80% độc tính thực vật quan sát được

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	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.111		I.113	

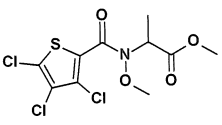
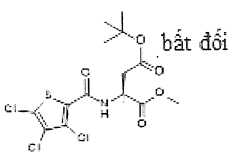
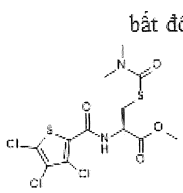
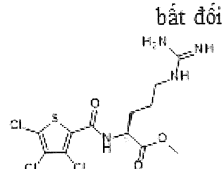
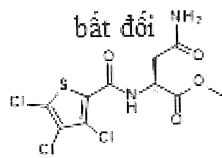
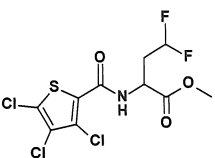
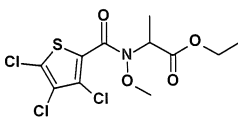
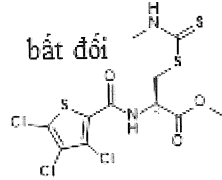
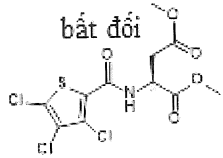
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 125 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 125 ppm, hợp chất I.111 đã thể hiện hiệu lực 70% trong đó CMP1 thể hiện hiệu lực dưới 10% 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.113 đã thể hiện hiệu lực ít nhất là 80% trong khi đó CMP1 đã thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP2 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.109		I.136		I.142	
I.008		I.015		I.016	
I.108		I.140		I.144	

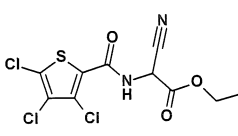
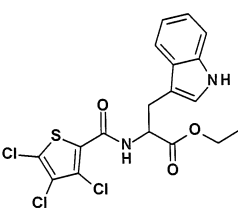
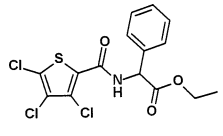
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP2 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 125 ppm.

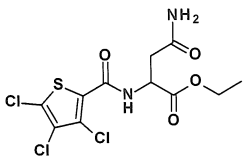
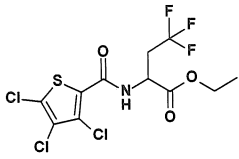
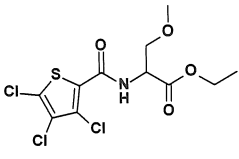
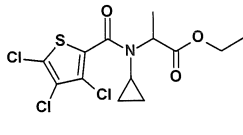
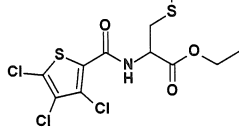
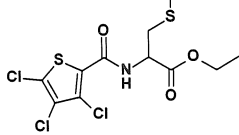
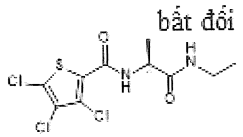
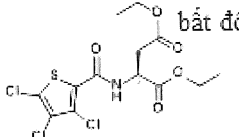
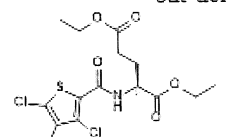
Cụ thể hơn, ở nồng độ 125 ppm, các hợp chất I.109, I.136, I.142, đã thể hiện hiệu lực là 70% trong khi CMP2 đã thể hiện độc tính thực vật trên 80% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP2 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.008, I.015, I.016, I.108, I.136, I.140, I.142, I.144 đã thể hiện hiệu lực ít nhất là 80% trong khi đó CMP2 đã thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP3 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.009		I.013		I.064	

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.046		I.048		I.059	
I.110		I.143		I.145	
I.120		I.138		I.137	

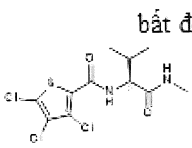
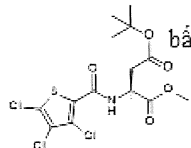
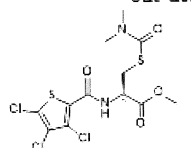
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP3 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 125 ppm.

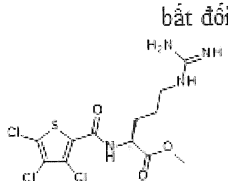
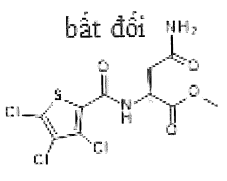
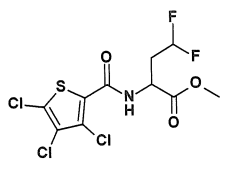
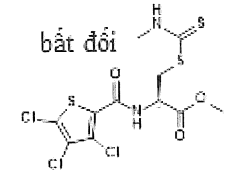
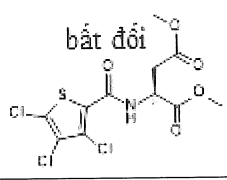
Cụ thể hơn, ở nồng độ 125 ppm, các hợp chất I.009, I.013, I.064, I.046, I.048, I.059, I.110, I.143, I.145 đã thể hiện hiệu lực là 70% trong khi đó CMP3 đã thể hiện độc tính đối với thực vật trên 80% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP3 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.009, I.110, I.120, I.046, I.059, I.138, I.137, I.143, I.145 đã thể hiện là có hiệu lực ít nhất là 70% trong khi đó CMP3 đã thể hiện là không có hiệu lực ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP4 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.096		I.136		I.142	

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.008		I.015		I.016	
I.140		I.144			

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP4 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.096, I.136, I.142 đã thể hiện là có hiệu lực là 70% trong khi CMP4 đã thể hiện là không có hiệu lực 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 CMP34 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

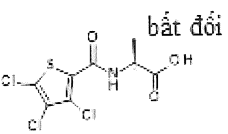
Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, các hợp chất I.008, I.015, I.016, I.136, I.140, I.142, I.144 đã thể hiện hiệu lực ít nhất là 80% trong khi đó CMP4 đã thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

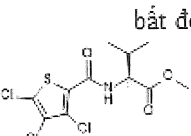
Ví dụ L: Các ví dụ so sánh

Các hợp chất CMP1 và CMP4 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (bệnh đốm vi khuẩn trên cà chua) trong các điều kiện tương tự như được mô tả trong ví dụ J.

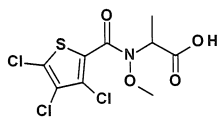
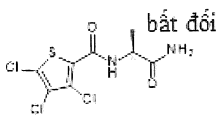
Các hợp chất CMP1 và CMP4 được điều chế theo hướng dẫn của EP0450355.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 500 ppm
CMP1		17

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP4		0

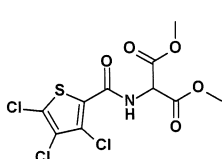
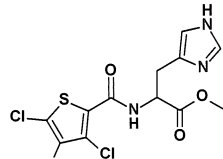
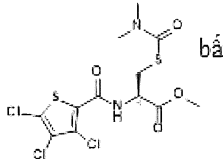
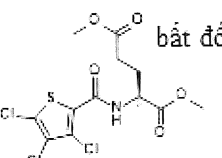
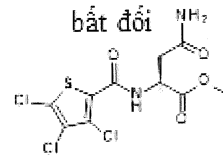
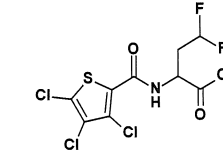
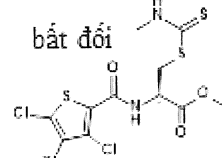
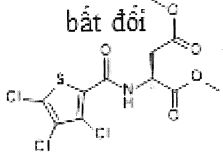
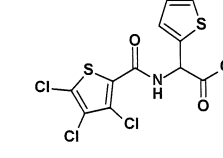
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP1 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.111		I.119	

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 500 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 500 ppm, các hợp chất I.111, I.119 đã thể hiện hiệu lực ít nhất là 80% trong khi đó CMP1 đã thể hiện hiệu lực dưới 20% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP4 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.007		I.012		I.142	
I.139		I.015		I.016	
I.140		I.144		I.124	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP4 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

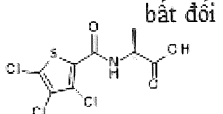
Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, các hợp chất I.007, I.012, I.015, I.016, I.124, I.139, I.140, I.142, I.144 đã thể hiện là có hiệu lực ít nhất là 70% trong khi đó CMP4 đã thể hiện là không có hiệu lực ở cùng nồng độ.

Ví dụ M: Ví dụ so sánh

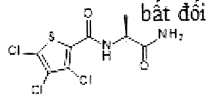
Hợp chất CMP1 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* đối với *Colletotrichum lindemuthianum* (gây bệnh thán thư trên đậu) ở cùng điều kiện như được mô tả trong ví dụ F.

Hợp chất CMP1 được điều chế theo hướng dẫn trong EP0450355.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 31 ppm
CMP1		23

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	Cấu trúc
I.119	

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.

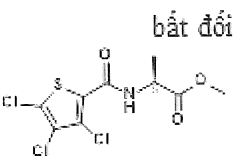
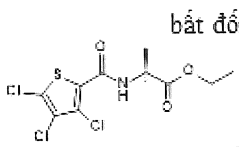
Cụ thể hơn, ở nồng độ 31 ppm, hợp chất I.119 đã thể hiện là có hiệu lực ít nhất là 70% trong khi đó CMP1 đã thể hiện là có hiệu lực dưới 20% ở cùng nồng độ.

Ví dụ N: Các ví dụ so sánh

Các hợp chất CMP2 và CMP3 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Peronospora parasitica* (Crucifer downy mildew) trong các điều kiện giống như được mô tả trong ví dụ G.

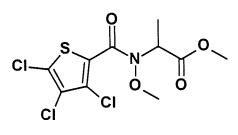
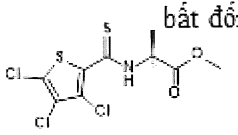
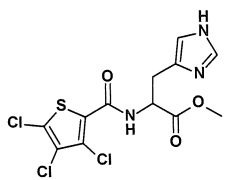
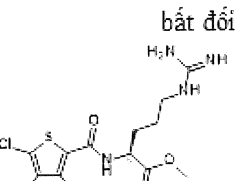
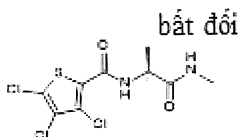
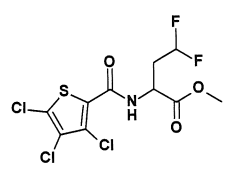
Các hợp chất CMP2 và CMP3 được điều chế theo hướng dẫn của EP0450355.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 500 ppm
CMP2		*
CMP3		*

* Không đo lường được hiệu lực do hơn 80% độc tính thực vật quan sát được

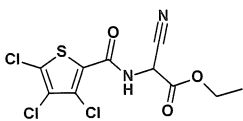
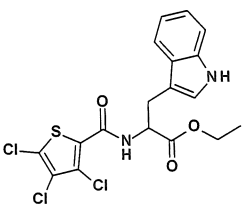
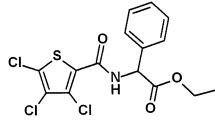
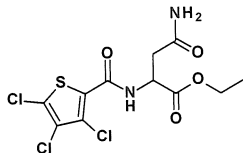
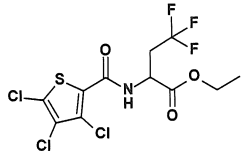
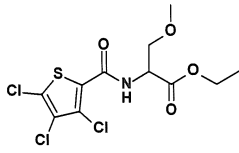
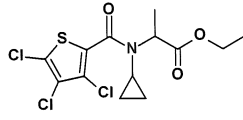
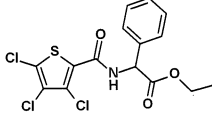
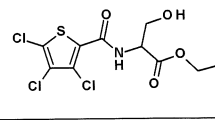
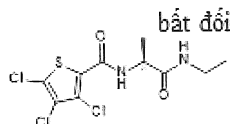
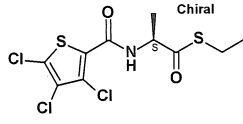
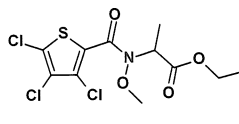
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP2 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.109		I.117		I.012	
I.008		I.091		I.016	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP2 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 500 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 500 ppm, các hợp chất I.008, I.012, I.016, I.091, I.109, I.117 đã thể hiện là có hiệu lực là 90% trong khi đó CMP2 đã thể hiện là có độc tính đối với thực vật là trên 80% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP3 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.009		I.013		I.064	
I.046		I.048		I.059	
I.110		I.064		I.078	
I.120		I.089		I.108	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP3 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 500 ppm.

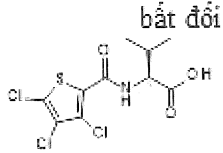
Cụ thể hơn, ở nồng độ 500 ppm, các hợp chất I.009, I.013, I.046, I.048, I.059, I.064, I.078, I.089, I.108, I.110, I.118, I.120 đã thể hiện là có hiệu lực là 70% trong khi đó CMP3 đã thể hiện là có độc tính đối với thực vật là trên 80% ở cùng nồng độ.

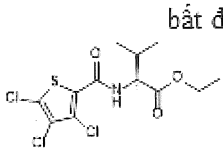
Ví dụ O: Các ví dụ so sánh

Các hợp chất CMP5 và CMP6 được thử nghiệm trong thử nghiệm ngăn ngừa *in vivo* trên *Uromyces appendiculatus* (bệnh rỉ sắt ở đậu) trong cùng điều kiện như được mô tả trong ví dụ I.

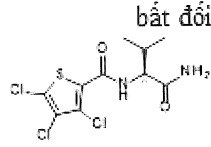
Các hợp chất CMP5 và CMP6 được điều chế theo hướng dẫn của EP0450355.

Kết quả được thể hiện trong bảng sau.

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 8 ppm
CMP5		12

Ví dụ	Cấu trúc	Hiệu lực (%) ở 500 ppm
CMP6		31

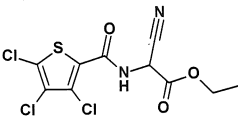
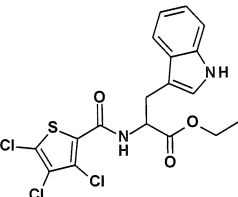
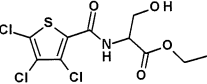
Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP5 có liên quan về cấu trúc.

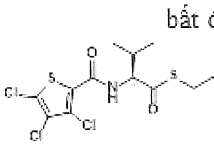
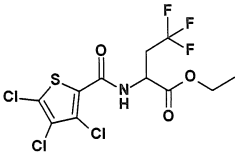
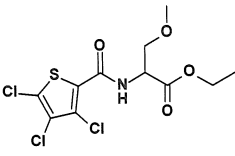
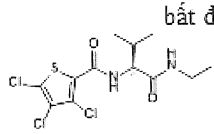
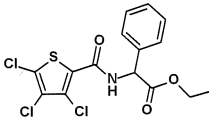
Ví dụ	Cấu trúc
I.147	

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP5 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 8 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 8 ppm, hợp chất I.147 đã thể hiện là có hiệu lực ít nhất là 90% trong khi đó CMP5 đã thể hiện là có hiệu lực dưới 20% ở cùng nồng độ.

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế trong bảng sau đây thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP6 có liên quan về cấu trúc.

Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.009		I.013		I.078	

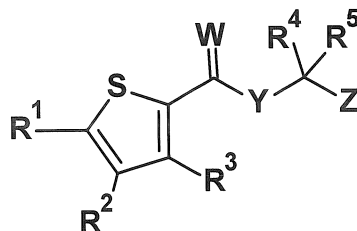
Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc	Ví dụ	Cấu trúc
I.09 4	 bất đối	I.048		I.059	
I.09 0	 bất đối	I.064			

Các hợp chất có công thức (I) theo sáng chế đã thể hiện hiệu lực tốt hơn so với hợp chất CMP6 có liên quan về cấu trúc khi được thử nghiệm ở nồng độ 31 ppm.

Cụ thể hơn, ở nồng độ 500 ppm, các hợp chất I.009, I.013, I.048, I.059, I.064, I.078, I.090, I.094 đã thể hiện hiệu lực ít nhất là 90% trong khi đó CMP6 đã thể hiện hiệu lực dưới 40% ở cùng nồng độ.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):



(I)

trong đó

mỗi R^1 , R^2 và R^3 là clo;

R^4 và R^5 được chọn độc lập với nhau từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -hydroxyalkyl, vòng cacbon C_3 - C_6 , $C(=O)$ -OH, $-C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -alkoxy, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_1 - C_6 -haloalkyl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-vòng cacbon C_3 - C_6 , $-C_1$ - C_6 -alkyl-aryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-hydroxyaryl, $-C_1$ - C_6 -alkyl-S- C_1 - C_6 -alkyl-, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -NH₂, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -OH, $-C_1$ - C_6 -alkyl- $C(=O)$ -O- C_1 - C_6 -alkyl; hoặc 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 NR⁸ với R^8 là hydro;

Z được chọn từ nhóm bao gồm $-C(=O)$ -OR^a, trong đó R^a được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -xyanoalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, aryl, aralkyl, heteroxyclyl không thơm 4, 5 hoặc 6 cạnh, $-C_1$ - C_6 -alkyl-Si(C_1 - C_6 -alkyl)₃, $-C_1$ - C_6 -alkyl- C_3 - C_8 -xycloalkyl, heteroaryl 5 đến 9 cạnh và $-C_1$ - C_6 -alkyl-heteroaryl 5 đến 9 cạnh, hoặc R^a có thể cùng với R^4 và với các nguyên tử mà chúng gắn vào tạo thành dị vòng 4 đến 7 cạnh;

với điều kiện là các hợp chất trong đó R^4 được chọn từ nhóm bao gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl-aryl, C_1 - C_6 -alkyl-hydroxyaryl, xyclopropyl và R^5 là hydro hoặc R^4

và R^5 cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành xyclopropyl được loại trừ khỏi các hợp chất có công thức (I);

và muối, N-oxit và solvat của hợp chất có công thức (I).

2. Chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và ít nhất một chất phụ trợ thích hợp trong nông nghiệp.

3. Phương pháp phòng trừ các bệnh do vi khuẩn và/hoặc nấm trên thực vật bao gồm bước áp dụng hợp chất theo điểm 1 hoặc chế phẩm theo điểm 2 cho thực vật, bộ phận của thực vật, hạt, quả hoặc cho đất mà trên đó thực vật sinh trưởng.