



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

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

(11)



1-0025558

(51)⁷ A01N 43/48

(13) B

(21) 1-2013-00713

(22) 01/09/2011

(86) PCT/US2011/050124 01/09/2011

(87) WO2012/031061 08/03/2012

(30) 61/378,982 01/09/2010 US; 61/416,346 23/11/2010 US; 61/438,356 01/02/2011 US;
61/510,137 21/07/2011 US

(45) 25/09/2020 390

(43) 25/07/2013 304A

(73) FMC Corporation (US)

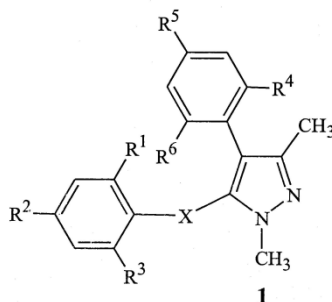
2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America

(72) LONG, Jeffrey, Keith (US); GREGORY, Vann (US); GUTTERIDGE, Steven (US);
TAGGI, Andrew, Edmund (US); BEREZNAK, James, Francis (US).

(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT PYRAZOL CÓ HOẠT TÍNH DIỆT NẤM, CHẾ PHẨM CHỨA
CHÚNG VÀ PHƯƠNG PHÁP BẢO VỆ THỰC VẬT

(57) Sáng chế đề cập đến chế phẩm diệt nấm chứa (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, và muối của chúng,



trong đó R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 như được xác định trong phần mô tả;
và (b) ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung.

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó, hoặc lên hạt giống thực vật, hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, hoặc muối của chúng (ví dụ, như là một hợp phần trong chế phẩm nêu trên) với một lượng hữu hiệu diệt nấm. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm chứa (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1 nêu trên, *N*-oxit, và muối của chúng; và ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

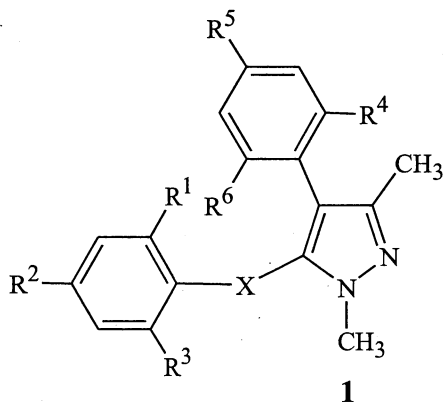
Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất pyrazol nhất định, N-oxit và muối của chúng, và hỗn hợp và chế phẩm chứa các dẫn xuất pyrazol này và phương pháp sử dụng các dẫn xuất pyrazol và hỗn hợp và chế phẩm chứa chúng làm thuốc diệt nấm.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Việc kiểm soát các bệnh thực vật gây ra bởi các nấm gây bệnh thực vật là rất quan trọng để đạt được vụ mùa thu hoạch cao. Thiệt hại do bệnh thực vật gây ra đối với cây cảnh, rau, cây trồng ngoài cánh đồng, cây ngũ cốc và cây cho quả có thể làm giảm đáng kể năng suất và worse thể dẫn đến sự tăng giá đối với người tiêu dùng. Ngoài việc gây thiệt hại lớn, các bệnh thực vật cũn có thể khó kiểm soát và làm tăng sự kháng các chất diệt nấm đang có trên thị trường. Trên thị trường đã có nhiều sản phẩm dùng cho mục đích này, nhưng vẫn cần tìm ra các hợp chất diệt nấm mới hữu hiệu hơn, giá thành rẻ hơn, ít gây độc hơn, an toàn hơn cho môi trường hoặc có các vị trí tác động khác nhau. Ngoài việc tìm ra các thuốc diệt nấm mới, chế phẩm phối hợp thường được sử dụng để tạo thuận lợi cho việc phòng trừ bệnh, mở rộng phổ phòng trừ bệnh và làm chậm sự phát triển của tính đề kháng. Ngoài ra, một số ít các chế phẩm phối hợp của các chất diệt nấm chứng minh tác dụng cao-hơn-tổng (nghĩa là có tính hiệp đồng) cho phép kiểm soát được bệnh thực vật ở quy mô lớn. Các điểm ưu việt của các chế phẩm phối hợp các chất diệt nấm được thừa nhận trong lĩnh vực chuyên ngành thay đổi, phụ thuộc vào các yếu tố như các loài thực vật và các bệnh thực vật cụ thể sẽ được xử lý, và vào việc thực vật được xử lý trước hay sau khi nhiễm nấm gây bệnh thực vật. Do đó, các chế phẩm phối hợp này là cần thiết để có thể có được nhiều lựa chọn đáp ứng được tốt nhất nhu cầu kiểm soát các bệnh thực vật cụ thể. Các chế phẩm phối hợp đặc biệt ưu việt sẽ được mô tả dưới đây. JP08208620 đã mô tả các dẫn xuất *N*-phenylpyrazolylamin dùng làm thuốc trừ sâu, thuốc diệt cỏ và thuốc diệt nấm; tuy nhiên tài liệu công bố này không bộc lộ các hợp chất pyrazol diệt nấm theo sáng chế và hỗn hợp chúng.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất chế phẩm diệt nấm (tức là dạng phối hợp) chứa (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả chất đồng phân tách thể), *N*-oxit, và muối của chúng:



trong đó:

X là CHOH, O hoặc NH;

R¹ là halogen hoặc metyl;

R² là H, xyano, halogen hoặc C₁–C₂ alkoxy;

R³ là H, halogen hoặc metyl;

R⁴ là halogen;

R⁵ là H, xyano, halogen hoặc C₁–C₂ alkoxy; và

R⁶ là H hoặc halogen; và

(b) ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung.

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa: (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1 đã nêu trên, *N*-oxit, và muối của chúng; và ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống.

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa một trong các chế phẩm nêu trên chứa hợp phần (a) và ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng.

Sáng chế còn đề xuất phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó, hoặc lên hạt giống thực vật, một trong các chế phẩm nêu trên với một lượng hữu hiệu diệt nấm .

Ngoài ra, phương pháp nêu trên cũng có thể được mô tả là phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa một trong các chế phẩm nêu trên một lượng hữu hiệu diệt nấm lên thực vật (hoặc bộ phận của nó) hoặc hạt giống thực vật (trực tiếp hoặc đưa vào môi trường (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của thực vật hoặc hạt giống thực vật).

Sáng chế còn đề xuất hợp chất có công thức 1 đã nêu trên, hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng. Sáng chế còn đề xuất chế phẩm diệt nấm chứa hợp chất có công thức 1, hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng, và ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng. Ngoài ra, sáng chế còn đề xuất phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra chứa hợp chất có công thức 1, hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng với một lượng hữu hiệu diệt nấm, lên thực vật hoặc hạt giống thực vật.

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo sáng chế, các thuật ngữ “chứa”, “có chứa”, “gồm có”, “gồm”, “có”, “có chứa”, “đặc trưng bởi” hoặc dạng biến đổi bất kỳ khác của chúng, được dùng để chỉ việc bao hàm không loại trừ các yếu tố khác, ngoài phạm vi giới hạn được chỉ ra cụ thể. Ví dụ, chế phẩm, quy trình, phương pháp, sản phẩm, hoặc thiết bị gồm có danh sách các yếu tố không nhất thiết là chỉ giới hạn ở các yếu tố này mà có thể còn bao gồm các yếu tố khác ngoài các yếu tố đã nêu hoặc là vốn vẫn có trong thành phần, quy trình, phương pháp, sản phẩm, hoặc thiết bị này.

Cụm từ “được cấu thành từ” loại trừ yếu tố, bước hoặc thành phần không được nêu cụ thể. Nếu trong yêu cầu bảo hộ thì cụm từ này sẽ không bao hàm trong yêu cầu bảo hộ các thành phần ngoài các thành phần được nêu ra ngoại trừ các tạp chất thường đi kèm theo chúng. Khi cụm từ “cấu thành từ” xuất hiện trong mệnh đề của phần khác biệt, chứ không phải là ngay lập tức sau phần giới hạn, cụm từ này chỉ giới hạn ở các thành phần được nêu ra trong mệnh đề đó; các thành phần khác không bị loại trừ ra khỏi yêu cầu bảo hộ xét về tổng thể.

Cụm từ “về cơ bản được cấu thành từ” được sử dụng để xác định chế phẩm hoặc phương pháp bao gồm các chất liệu, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố, ngoài chất liệu, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố được bộc lộ trong tài liệu, với điều kiện các chất liệu, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố bổ sung này không gây ảnh hưởng nhiều đến các đặc tính cơ bản và mới của đối tượng sáng chế. Thuật ngữ “về cơ bản được cấu thành từ” ở mức độ giữa “chứa” và “được cấu thành từ”.

Khi Người nộp đơn xác định sáng chế hoặc một phần của nó bằng thuật ngữ có kết mở chẳng hạn như từ “chứa”, cần phải hiểu rằng (trừ khi có chỉ dẫn khác) phần mô tả cần được giải thích để sáng chế cũng được mô tả bằng cách sử dụng các thuật ngữ “về cơ bản được cấu thành từ” hoặc “được cấu thành từ”.

Ngoài ra, trừ khi chỉ có dẫn khác, “hoặc” dùng để chỉ hoặc bao hàm chứ không phải hoặc loại trừ. Ví dụ, điều kiện “A hoặc B” được thoả mãn trong các trường hợp sau: A đúng (hoặc có mặt) và B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Cũng như vậy, theo sáng chế, mạo từ không xác định “a” và “an” trong bản mô tả tiếng Anh đứng trước một yếu tố hoặc thành phần có nghĩa chỉ tính không giới hạn về số lượng các trường hợp (tức là các sự kiện) của yếu tố hoặc thành phần này. Do đó, “một” cần được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và yếu tố hoặc thành phần ở dạng số ít cũng bao gồm cả dạng số nhiều trừ khi số này được hiểu một cách hiển nhiên là ở dạng số ít.

Khi được đề cập đến trong phần mô tả và trong các Điểm yêu cầu bảo hộ, "thực vật" bao gồm thực vật thuộc giới thực vật Kingdom Plantae, đặc biệt là cây giống (Spermatopsida), ở tất cả giai đoạn phát triển, bao gồm cây non (chẳng hạn, hạt nảy mầm phát triển thành cây giống) và các giai đoạn trưởng thành, sinh sản (chẳng hạn, cây ra hoa và hạt). Phần của thực vật bao gồm các phần hướng đất thường phát triển bên dưới bề mặt của môi trường sinh trưởng (chẳng hạn, đất), chẳng hạn như rễ, củ, hành và thân hành, và cả các phần phát triển phía trên môi trường sinh trưởng, chẳng hạn như lá (bao gồm thân và lá), hoa, quả và hạt.

Như được nêu trong bản mô tả này, thuật ngữ "cây con", khi được dùng đơn lẻ hoặc trong từ kết hợp dùng để chỉ cây mới phát triển từ phôi hạt giống.

Trong phần nêu trên, thuật ngữ "alkoxy" bao gồm, ví dụ như, metoxy và etoxy. Thuật ngữ "halogen" bao gồm flo, clo, brom hoặc iot.

Tổng số nguyên tử cacbon trong một nhóm thế được biểu thị bằng tiếp đầu ngữ " C_i-C_j " trong đó i và j là các số từ 1 đến 2.

Các hợp chất có liên quan đến các chế phẩm và phương pháp theo sáng chế có thể tồn tại dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân tách thể. Các chất đồng phân tách thể khác nhau bao gồm các chất đồng phân đối ảnh, các chất đồng phân không đối quang, đồng phân atropisome và chất đồng phân hình học. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ nhận biết rằng một đồng phân tách thể có thể có hoạt tính cao hơn và/hoặc có thể thể hiện nhiều tác dụng có lợi khi được làm giàu so với (các) đồng phân tách thể khác hoặc khi được tách riêng ra khỏi (các) đồng phân tách thể khác. Ngoài ra, chuyên gia trong lĩnh vực biết cách thức tách riêng, làm giàu, và/hoặc điều chế chọn lọc chất đồng phân tách thể nêu trên. Các hợp chất trong chế phẩm theo sáng chế có thể tồn tại dưới dạng hỗn hợp của các chất đồng phân tách thể, các chất đồng phân tách thể riêng rẽ hoặc dưới dạng có hoạt tính quang học.

Các phương pháp tổng hợp để điều chế *N*-oxit của các hợp chất dị vòng chẳng hạn như pyrazol đã được người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này biết đến bao gồm phương pháp oxy hoá các hợp chất dị vòng bằng các axit peroxy chẳng

hạn như axit peraxetic và *m*-cloperbenzoic (MCPBA), hydro peroxit, alkyl hydroperoxit chẳng hạn như *t*-butyl hydroperoxit, natri perborat, và dioxiran chẳng hạn như dimetylđioxiran. Các phương pháp điều chế *N*-oxit này đã được mô tả kỹ và được bàn luận trong các ấn phẩm, xem chẳng hạn: T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler và B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press, A. J. Boulton và A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett và B. R. T. Keene trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler và B. Stanovnik trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press; và G. W. H. Cheeseman và E. S. G. Werstiuk trong *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này nhận biết rằng vì trong môi trường và trong điều kiện sinh lý, muối của các hợp chất hóa học ở dạng cân bằng với dạng không phải là muối tương ứng của chúng, các muối có đặc tính sinh học giống như dạng không phải là muối tương ứng. Do đó, nhiều muối của hợp chất có công thức 1 ở dạng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp là hữu ích để phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra (tức là thích hợp để dùng trong nông nghiệp). Các muối của hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc axit hữu cơ chẳng hạn như axit bromhydric, clohydric, nitric, phosphoric, sulfuric, axetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salixylic, tartaric, 4-toluensulfonic hoặc valeric. Theo đó, sáng chế đề cập đến hỗn hợp của các hợp chất được chọn từ Công thức 1, *N*-oxit và muối thích hợp dùng trong nông nghiệp của chúng.

Các hợp chất được chọn từ Công thức 1, chất đồng phân tách thể, các dạng hỗn hợp, *N*-oxit, và muối của chúng, thường tồn tại ở nhiều hơn một dạng, và do đó hợp chất có công thức 1 bao gồm tất cả các dạng hợp chất có Công thức 1 ở dạng tinh thể và không ở dạng tinh thể. Các dạng không ở dạng tinh thể bao gồm các phương án là

các chất rắn chẳng hạn như chất sáp và gồm cũng như các phương án là các chất lỏng chẳng hạn như các dung dịch và dạng nóng chảy. Các dạng tinh thể bao gồm các phương án cơ bản là dạng đơn tinh thể và các phương án là hỗn hợp gồm các dạng đa hình (tức là ở các dạng tinh thể khác nhau). Thuật ngữ “dạng đa hình” dùng để chỉ dạng tinh thể nhất định của hợp chất hoặc học mà có thể kết tinh thành các dạng tinh thể khác nhau, các dạng này có sự bố trí và/hoặc cấu dạng của các phân tử trong mạng tinh thể khác nhau. Mặc dù các dạng đa hình có thể có thành phần hoá học giống nhau, chúng cũng có thể khác nhau về thành phần do sự có mặt hoặc không có mặt nước hoặc các phân tử khác đồng kết tinh, mà có thể được liên kết yếu hoặc liên kết mạnh trong mạng tinh thể. Các dạng đa hình có thể khác nhau về các đặc tính hoá học, vật lý và sinh học như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ ổn định hoá học, nhiệt độ nóng chảy, khả năng hút ẩm, khả năng tạo huyền phù, tốc độ hoà tan và sự có sẵn phản ứng sinh học. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ nhận biết rằng một dạng đa hình của hợp chất có Công thức 1 có thể thể hiện tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế các chế phẩm hữu ích, có đặc tính sinh học được cải thiện) so với dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp các dạng đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Có thể thực hiện việc điều chế và phân tách dạng đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 bằng các phương pháp đã biết đối với các người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này bao gồm, ví dụ như, kết tinh bằng cách sử dụng dung môi và nhiệt độ chọn lọc.

Như mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, một khía cạnh của sáng chế là đề cập đến chế phẩm chứa (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ hợp chất có Công thức 1, *N*-oxit, và muối của chúng, với (b) ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung. Đặc biệt hơn, hợp phần (b) được chọn từ nhóm bao gồm

(b1) các thuốc diệt nấm methyl benzimidazole carbamat (MBC);

(b2) các thuốc diệt nấm đicarboximit;

(b3) các thuốc diệt nấm là chất ức chế khử methyl (DMI);

(b4) các thuốc diệt nấm phenylamit;

- (b5) các thuốc diệt nấm amin/morpholin;
- (b6) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp phospholipit;
- (b7) các thuốc diệt nấm carboxamit;
- (b8) các thuốc diệt nấm hydroxy(2-amino-)pyrimidin;
- (b9) các thuốc diệt nấm anilinopyrimidin;
- (b10) các thuốc diệt nấm *N*-phenyl carbamat;
- (b11) các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon (QoI);
- (b12) các thuốc diệt nấm phenylpyrol;
- (b13) các thuốc diệt nấm quinolin;
- (b14) các thuốc diệt nấm là chất ức chế quá trình peroxy hóa của lipid;
- (b15) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-reductaza (MBI-R);
- (b16) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-dehydrataza (MBI-D);
- (b17) các thuốc diệt nấm hydroxylanilit;
- (b18) các thuốc diệt nấm là chất ức chế squalen-epoxidaza;
- (b19) các thuốc diệt nấm polyoxin;
- (b20) các thuốc diệt nấm phenylure;
- (b21) các thuốc diệt nấm chất ức chế ở vị trí bên trong quinon (QiI);
- (b22) các thuốc diệt nấm benzamide;
- (b23) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh là axit enopyranuronic;
- (b24) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh hexopyranosyl;
- (b25) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế tổng hợp protein ;

(b26) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế sinh tổng hợp trehalaza và inositol;

(b27) các thuốc diệt nấm xyanoaxetamitoxim;

(b28) các thuốc diệt nấm carbamat;

(b29) các thuốc diệt nấm làm mất kết hợp quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa;

(b30) các thuốc diệt nấm là hợp chất thiếc hữu cơ;

(b31) các thuốc diệt nấm là axit carboxylic ;

(b32) các thuốc diệt nấm dị vòng thơm;

(b33) các thuốc diệt nấm phosphonat;

(b34) các thuốc diệt nấm axit phtalamic ;

(b35) các thuốc diệt nấm benzotriazin;

(b36) các thuốc diệt nấm benzen-sulfonamit;

(b37) các thuốc diệt nấm pyridazinon;

(b38) các thuốc diệt nấm thiophen-carboxamit;

(b39) các thuốc diệt nấm pyrimidinamit;

(b40) các thuốc diệt nấm là amit của axit carboxylic (CAA, là viết tắt của carboxylic acid amide);

(b41) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh tetracyclin;

(b42) các thuốc diệt nấm thiocarbamat;

(b43) các thuốc diệt nấm benzamide;

(b44) các thuốc diệt nấm cảm ứng cơ chế phòng vệ của thực vật chủ;

(b45) các thuốc diệt nấm có hoạt tính tiếp xúc nhiều vị trí;

(b46) các thuốc diệt nấm không phải là các thuốc diệt nấm hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45); và muối của các hợp chất từ (b1) đến (b46).

Đáng lưu ý là các phương án trong đó hợp phần (b) chứa ít nhất một hợp chất diệt nấm từ mỗi trong số hai nhóm khác nhau được chọn từ (b1) đến (b46).

“Các thuốc diệt nấm methyl benzimidazole carbamat (MBC)(b1)” (FRAC (ủy ban nghiên cứu tác động tính kháng chất diệt nấm) mã 1) ức chế sự phân bào có tơ bằng cách gắn kết với β -tubulin trong quá trình lắp ghép sợi thoi. Sự ức chế quá trình lắp ghép sợi thoi có thể phá vỡ sự phân chia tế bào, sự chuyển vận trong tế bào và cấu trúc tế bào. Các thuốc diệt nấm methyl benzimidazole carbamat bao gồm các thuốc diệt nấm benzimidazole và thiophanate. Các benzimidazole bao gồm benomyl, carbendazim, fuberidazole và thiabendazole. Các thiophanate bao gồm thiophanate và thiophanate-methyl.

“Các thuốc diệt nấm dicarboximit (b2)” (FRAC mã 2) được đề xuất để ức chế quá trình peroxy hóa lipid trong nấm gây ảnh hưởng đến reductaza sắc tố tế bào NADH. Ví dụ bao gồm chlozolate, iprodione, procymidone và vinclozolin.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế khử methyl (DMI) (b3)” (FRAC mã 3) ức chế C14-demethylaza là chất đóng vai trò trong quá trình sản xuất sterol. Các sterol, chẳng hạn như ergosterol, là cần thiết cho quá trình cấu trúc và chức năng của màng, nên nó là thiết yếu cho sự phát triển của thành tế bào chức năng. Do đó, khi tiếp xúc với các thuốc diệt nấm này sẽ dẫn đến sự phát triển bất thường và cuối cùng gây chết nấm nhạy cảm. Các thuốc diệt nấm DMI được chia thành một số nhóm hoá chất: cácazole (bao gồm triazol và imidazol), pyrimidin, piperazin và pyridin. Các triazol bao gồm azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole (bao gồm diniconazole-M), epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prothioconazole, quinconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol,

triticonazole và uniconazole. Các imidazol bao gồm clotrimazole, econazole, imazalil, isoconazole, miconazole, oxpoconazole, prochloraz, pefurazoate và triflumizole. Các pyrimidin bao gồm fenarimol, nuarimol và triarimol. Các piperazin bao gồm triforine. Các pyridin bao gồm buthiobate và pyrifenox. Các nghiên cứu sinh hoá đã cho thấy là tất cả các thuốc diệt nấm được đề cập trên đây là các thuốc diệt nấm DMI như mô tả bởi K. H. Kuck et al. trong *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205–258.

“Các thuốc diệt nấm phenylamit (b4)” (FRAC mã 4) là các chất đặc hiệu ức chế polymeaza ARN ở nấm Oomycete. Các nấm nhạy cảm khi tiếp xúc với các thuốc diệt nấm này giảm khả năng kết hợp uridin thành rRNA. Nhóm chất diệt nấm này ngăn cản sự sinh trưởng và sự phát triển của nấm nhạy cảm. Các thuốc diệt nấm phenylamit bao gồm các thuốc diệt nấm axylalanin, oxazolidinone và butyrolacton. Các axylalanin này bao gồm benalaxyl, benalaxyl-M, furalaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M (còn được gọi là mefenoxam). Các oxazolidinone này bao gồm oxadixyl. Các butyrolacton bao gồm ofurace.

“Các thuốc diệt nấm amin/morpholin (b5)” (FRAC mã 5) ức chế hai vị trí đích trong quá trình sinh tổng hợp sterol, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerase và Δ^{14} reductase. Các sterol, chẳng hạn như ergosterol, là cần thiết cho cấu trúc và chức năng của màng, nên là yếu tố thiết yếu cho sự phát triển của thành tế bào chức năng. Do đó, sự tiếp cận với các thuốc diệt nấm này dẫn đến sự phát triển bất thường và cuối cùng giết chết nấm mẫn cảm. Các thuốc diệt nấm amin/morpholin (còn được biết đến như là các chất ức chế sinh tổng hợp sterol phi DMI) bao gồm các thuốc diệt nấm morpholin, piperidin và ketal vòng-amin. Các morpholin này bao gồm aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph và trimorphamide. Các piperidin bao gồm fenpropidin và piperalin. Các ketal vòng-amin bao gồm spiroxamin.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp phospholipit (b6)” (FRAC mã 6) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách gây ảnh hưởng đến quá trình sinh tổng hợp phospholipid. Các thuốc diệt nấm sinh tổng hợp phospholipid bao gồm các thuốc

diệt nấm phosphorothiolate và dithiolane. Các phosphorothiolate bao gồm edifenphos, iprobenfos và pyrazophos. Các dithiolane bao gồm isoprothiolane.

“Các thuốc diệt nấm carboxamit (b7)” (FRAC mã 7) ức chế sự hô hấp của nấm Phức hợp II (succinat dehydrogenaza) do phá vỡ enzym đóng vai trò trung tâm trong chu trình Krebs (chu trình TCA) có tên là succinat dehydrogenaza. Sự ức chế hô hấp ngăn cản quá trình tạo ra ATP của nấm, và do đó ức chế sự phát triển và sinh sản. Các thuốc diệt nấm carboxamit bao gồm benzamide, furan carboxamit, oxathiin carboxamit, thiazol carboxamit, pyrazol carboxamit và pyridin carboxamit. Các benzamide bao gồm benodanil, flutolanil và mepronil. Các furan carboxamit bao gồm fenfuram. Các oxathiin carboxamit bao gồm carboxin và oxycarboxin. Các thiazol carboxamit bao gồm thifluzamide. Các pyrazol carboxamit bao gồm bixafen, furametpyr, isopyrazam, fluxapyroxad, penthiopyrad, sedaxane (*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-bixyclopropyl]-2-ylphenyl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1*H*-pyrazol-4-carboxamit) và penflufen (*N*-[2-(1,3-đimetylbutyl)phenyl]-5-flo-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-carboxamit) (Công bố đơn PCT WO 2003/010149). Các pyridin carboxamit bao gồm boscalid.

“Các thuốc diệt nấm hydroxy(2-amino-)pyrimidin (b8)” (FRAC mã 8) ức chế tổng hợp axit nucleic do có tác động lên adenosin deaminaza. Các ví dụ bao gồm bupirimate, dimethirimol và ethirimol.

“Các thuốc diệt nấm anilinopyrimidin (b9)” (FRAC mã 9) được đề xuất nhằm ức chế sinh tổng hợp axit amin metionin và phá vỡ sự tiết enzym thuỷ phân làm phân huỷ các tế bào thực vật trong quá trình gây nhiễm. Ví dụ bao gồm cyprodinil, mepanipyrim và pyrimethanil.

“Các thuốc diệt nấm *N*-phenyl carbamat (b10)” (FRAC mã 10) ức chế sự phân bào có tơ bằng cách gắn kết với β -tubulin và phá vỡ sự lắp ghép sợi thoi. Sự ức chế lắp ráp sợi thoi có thể phá vỡ sự phân chia tế bào, sự chuyển vận trong tế bào và cấu trúc tế bào. Ví dụ bao gồm diethofencarb.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon (QoI) (b11)” (FRAC mã 11) ức chế sự hô hấp trong ty thể Phức hợp III ở nấm do tác động tới ubiquinol oxidaza. Sự oxy hoá của ubiquinol bị phong bế ở vị trí “bên ngoài quinon” (Q_o) của phức hợp *bc*₁ sắc tố tế bào, nằm ở màng ty thể bên trong của nấm. Sự ức chế hô hấp ở ty thể ngăn cản sự sinh trưởng và phát triển bình thường của nấm. Các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon bao gồm các thuốc diệt nấm metoxyacrylat, metoxycarbat, oximinoaxetat, oximinoaxetamit và dihydrodioxazin (được gọi chung là các thuốc diệt nấm strobilurin), và các thuốc diệt nấm oxazolidindion, imidazolinon và benzylcarbat. Các metoxyacrylat bao gồm azoxystrobin, enestroburin (SYP-Z071) và picoxystrobin. Các metoxycarbat bao gồm pyraclostrobin và pyrametostrobin. Các oximinoaxetat bao gồm kresoxim-metyl, pyraoxystrobin và trifloxystrobin. Các oximinoaxetamit bao gồm dimoxystrobin, metominostrobin, orysastrobin và α -(metoxyimino)-*N*-metyl-2-[[[1-[3-(triflo-metyl)phenyl]etoxy]imino]metyl]benzenaxetamit. Các dihydrodioxazin bao gồm fluoxastrobin. Các oxazolidindion bao gồm famoxadone. Các imidazolinon bao gồm fenamidone. Các benzylcarbat bao gồm pyribencarb.

“Các thuốc diệt nấm phenylpyrol (b12)” (FRAC mã 12) ức chế kinaza MAP protein liên quan đến quá trình vận chuyển tín hiệu thẩm thấu ở nấm. Fenpiclonil và fludioxonil là các ví dụ về nhóm chất diệt nấm này.

“Các thuốc diệt nấm quinolin (b13)” (FRAC mã 13) được đề xuất nhằm ức chế quá trình truyền tín hiệu bằng cách tác động đến G-protein trong quá trình truyền tín hiệu tế bào sớm. Đã chứng tỏ được rằng các chất này gây ảnh hưởng đến quá trình tạo bào tử và/hoặc quá trình gắn đĩa bám ở nấm gây bệnh phấn trắng. Quinoxifen là một ví dụ về nhóm chất diệt nấm này.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế quá trình peroxy hóa của lipit (b14)” (FRAC mã 14) được đề xuất để ức chế quá trình peroxy hóa của lipit gây ảnh hưởng đến quá trình tổng hợp màng ở nấm. Các thành viên của nhóm này, như etridiazole chẳng hạn, còn có thể ảnh hưởng đến các quá trình sinh học khác chẳng hạn như quá trình hô hấp và sinh tổng hợp melanin. Các thuốc diệt nấm liên quan đến quá trình

peroxy hóa của lipid bao gồm các thuốc diệt nấm cacbon thơm và 1,2,4-thiadiazol. Các cacbon thơm bao gồm biphenyl, chloroneb, dicloran, quintozone, tecnazene và tolclofos-metyl. Các 1,2,4-thiadiazol bao gồm etridiazole.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-reductaza (MBI-R) (b15)” (FRAC mã 16.1) ức chế bước khử naphtal trong quá trình sinh tổng hợp melanin. Melanin là yếu tố cần thiết để một số nấm gây nhiễm thực vật chủ. Các thuốc diệt nấm chất ức chế sinh tổng hợp melanin-reductaza bao gồm các thuốc diệt nấm isobenzofuranone, pyrroloquinolinone và triazolobenzothiazole. Các isobenzofuranone bao gồm fthalid. Các pyrroloquinolinone bao gồm pyroquilon. Các triazolobenzothiazol bao gồm tricyclazole.

“Các thuốc diệt nấm chất ức chế sinh tổng hợp melanin-dehydrataza (MBI-D) (b16)” (FRAC mã 16.2) ức chế dehydrataza scytalone quá trình sinh tổng hợp melanin. Melanin là yếu tố cần thiết để một số nấm gây nhiễm thực vật chủ. Các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-dehydrataza bao gồm xyclopropanecarboxamit, carboxamit và propionamit các thuốc diệt nấm. Các xyclopropanecarboxamit bao gồm carpropamid. Các carboxamit bao gồm diclocymet. Các propionamit bao gồm fenoxanil.

“Các thuốc diệt nấm hydroxylanilit (b17)” (FRAC mã 17) ức chế C4-demetylaza đóng vai trò trong quá trình sản xuất sterol. Ví dụ bao gồm fenhexamid.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế squalen-epoxidaza (b18)” (FRAC mã 18) ức chế squalen-epoxidaza trong quá trình sinh tổng hợp ergosterol. Các sterol chẳng hạn như ergosterol là các chất cần thiết cho cấu trúc và chức năng màng, nên chúng là thành phần thiết yếu cho sự phát triển của thành tế bào chức năng. Do đó, sự tiếp xúc với các thuốc diệt nấm này dẫn đến sự phát triển bất thường và cuối cùng giết chết nấm nhạy cảm. Các thuốc diệt nấm là chất ức chế squalen-epoxidaza bao gồm các thuốc diệt nấm thiocarbamat và alylamin. Các thiocarbamat bao gồm pyributicarb. Các alylamin bao gồm naftifine và terbinafine.

“Các thuốc diệt nấm polyoxin (b19)” (FRAC mã 19) ức chế chitin synthaza. Ví dụ bao gồm polyoxin.

“Các thuốc diệt nấm phenylure (b20)” (FRAC mã 20) được đề xuất gây ảnh hưởng đến sự phân chia tế bào. Ví dụ bao gồm pencycuron.

“Các thuốc diệt nấm là chất ức chế ở vị trí bên trong quinon (QiI) (b21)” (FRAC mã 21) ức chế sự hô hấp trong ty thể Phức hợp III ở nấm bằng cách tác động đến reductaza ubiquinol. Sự khử ubiquinol bị phong bế ở vị trí “bên trong quinon” (Qi) của phức hợp sắc tố tế bào bc_1 , nằm ở màng ty thể bên trong của nấm. Sự ức chế hô hấp trong ty thể ngăn cản sự sinh trưởng và phát triển bình thường của nấm. Các thuốc diệt nấm là chất ức chế ở vị trí bên trong quinon bao gồm các thuốc diệt nấm xyanoimidazol và sulfamoyltriazol. Các xyanoimidazol bao gồm cyazofamid. Các sulfamoyltriazol bao gồm amisulbrom.

“Các thuốc diệt nấm benzamide (b22)” (FRAC mã 22) ức chế sự phân bào có tơ bằng cách gắn kết với β -tubulin và phá vỡ sự lắp ráp sợi thoi. Sự ức chế lắp ráp sợi thoi có thể phá vỡ sự phân chia tế bào, sự chuyển vận trong tế bào và cấu trúc tế bào. Ví dụ bao gồm zoxamide.

“Các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh là axit enopyranuronic (b23)” (FRAC mã 23) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách tác động đến quá trình sinh tổng hợp protein. Ví dụ bao gồm blasticidin-S.

“Các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh hexopyranosyl (b24)” (FRAC mã 24) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách tác động đến quá trình sinh tổng hợp protein. Ví dụ bao gồm kasugamycin.

“Các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế tổng hợp protein (b25)” (FRAC mã 25) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách tác động đến quá trình sinh tổng hợp protein. Ví dụ bao gồm streptomycin.

“Các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế sinh tổng hợp trehalaza và inositol (b26)” (FRAC mã 26) ức chế trehalaza trong quá trình sinh tổng hợp inositol. Ví dụ bao gồm validamycin.

“Các thuốc diệt nấm xyanoaxetamitoxim (b27) (FRAC mã 27) bao gồm cymoxanil.

“Các thuốc diệt nấm carbamat (b28)” (FRAC mã 28) được xem là các chất ức chế sự phát triển của nấm đa vị trí. Các chất này được đề xuất để gây ảnh hưởng đến quá trình tổng hợp axit béo trong màng tế bào, và sau đó làm phá vỡ tính thấm thấu của màng tế bào. Propamacarb, iodocarb, và prothiocarb là các ví dụ về nhóm chất diệt nấm này.

“Các thuốc diệt nấm làm mất kết hợp quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa (b29)” (FRAC mã 29) ức chế sự hô hấp của nấm bằng cách làm mất kết hợp quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa. Sự ức chế hô hấp ngăn cản sự sinh trưởng và phát triển bình thường của nấm. Nhóm này bao gồm các 2,6-đinitroanilin chẳng hạn như fluazinam, pyrimidonehydrazone chẳng hạn như ferimzone và các đinitrophenyl crotonat chẳng hạn như dinocap, meptyldinocap và binapacryl.

“Các thuốc diệt nấm là hợp chất thiếc hữu cơ (b30)” (FRAC mã 30) ức chế synthaza adenosin triphosphat (ATP) trong quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa. Ví dụ bao gồm fentin axetat, fentin clorua và fentin hydroxit.

“Các thuốc diệt nấm là axit carboxylic (b31)” (FRAC mã 31) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách gây ảnh hưởng đến topoisomeraza nhóm II của axit deoxyribonucleic (ADN) (gyraza). Ví dụ bao gồm axit oxolinic.

“Các thuốc diệt nấm dị vòng thơm (b32)” (FRAC mã 32) được đề xuất để gây ảnh hưởng đến quá trình tổng hợp ADN/axit ribonucleic (ARN). Các thuốc diệt nấm dị vòng thơm bao gồm các thuốc diệt nấm isoxazol và isothiazolon. Các isoxazol bao gồm hymexazole và các isothiazolon bao gồm octhilinone.

“Các thuốc diệt nấm phosphonat (b33)” (FRAC mã 33) bao gồm axit phosphorơ và các muối khác nhau của nó, bao gồm fosetyl-nhôm.

“Các thuốc diệt nấm axit phtalamic (b34)” (FRAC mã 34) bao gồm teclofthalam.

“Các thuốc diệt nấm benzotriazin (b35)” (FRAC mã 35) bao gồm triazoxide.

“Các thuốc diệt nấm benzen-sulfonamit (b36)” (FRAC mã 36) bao gồm flusulfamide.

“Các thuốc diệt nấm pyridazinon (b37)” (FRAC mã 37) bao gồm diclomezine.

“Các thuốc diệt nấm thiophen-carboxamit (b38)” (FRAC mã 38) được đề xuất để gây ảnh hưởng đến quá trình sản xuất ATP. Ví dụ bao gồm silthiofam.

“Các thuốc diệt nấm pyrimidinamit (b39)” (FRAC mã 39) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách gây ảnh hưởng đến quá trình sinh tổng hợp phospholipid và bao gồm diflumetorim.

“Các thuốc diệt nấm là amit của axit carboxylic (CAA) (b40)” (FRAC mã 40) được đề xuất để ức chế sự sinh tổng hợp phospholipit và sự đóng bám thành tế bào. Sự ức chế các quá trình này ngăn cản sự phát triển và dẫn đến sự chết của nấm đích. Các thuốc diệt nấm amit của axit carboxylic bao gồm các thuốc diệt nấm amit của axit xinamic, valinamit carbamat và amit của axit mandelic. Các amit của axit xinamic bao gồm dimethomorph và flumorph. Các valinamit carbamat bao gồm benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, iprovalicarb và valifenalate (valiphenal). Các amit của axit mandelic bao gồm mandipropamid, *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(metylsulfonyl)amino]butanamit và *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(etylsulfonyl)amino]butanamit.

“Các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh tetracyclin (b41)” (FRAC mã 41) ức chế sự phát triển của nấm bằng cách gây ảnh hưởng đến oxidoreductaza nicotinamit adenin dinucleotit (NADH) phức hợp 1. Ví dụ bao gồm oxytetracyclin.

“Các thuốc diệt nấm thiocarbamat (b42)” (FRAC mã 42) bao gồm methasulfocarb.

“Các thuốc diệt nấm benzamide (b43)” (FRAC mã 43) ức chế sự phát triển của nấm bằng khử định vị của các protein như spectrin. Ví dụ bao gồm các thuốc diệt nấm axylpicolit chẳng hạn như fluopicolide và fluopyram.

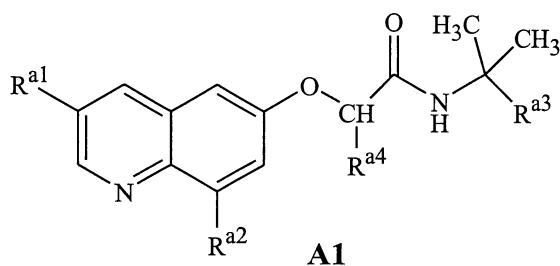
“Các thuốc diệt nấm cảm ứng cơ chế phòng vệ của thực vật chủ (b44)” (FRAC mã P) bao gồm các cơ chế bảo vệ của thực vật chủ. Cảm ứng cơ chế phòng vệ của thực vật chủ các thuốc diệt nấm bao gồm các thuốc diệt nấm benzo-thiadiazol, benzisothiazol và thiadiazol-carboxamit. Các benzo-thiadiazol bao gồm acibenzolar-*S*-methyl. Các benzisothiazol bao gồm probenazole. Các thiadiazol-carboxamit bao gồm tiadinil và isotianil.

“Các thuốc diệt nấm tiếp xúc đa vị trí (b45)” ức chế sự phát triển của nấm thông qua nhiều vị trí tác động và có hoạt tính tiếp xúc /phòng ngừa. Nhóm các thuốc diệt nấm này bao gồm: “các thuốc diệt nấm đồng (b45.1) (FRAC mã M1)”, “các thuốc diệt nấm lưu huỳnh (b45.2) (FRAC mã M2)”, “các thuốc diệt nấm dithiocarbamat (b45.3) (FRAC mã M3)”, “các thuốc diệt nấm phtalimit (b45.4) (FRAC mã M4)”, “các thuốc diệt nấm clonitril (b45.5) (FRAC mã M5)”, “các thuốc diệt nấm sulfamit (b45.6) (FRAC mã M6)”, “các thuốc diệt nấm guanidin (b45.7) (FRAC mã M7)” “các thuốc diệt nấm triazin (b45.8) (FRAC mã M8)” và “các thuốc diệt nấm quinon (b45.9) (FRAC mã M9)”. “Các thuốc diệt nấm đồng” là các hợp chất vô cơ chứa đồng, thông thường ở dạng oxy hoá của đồng(II); Ví dụ bao gồm đồng oxyclorea, đồng sulfat và đồng hydroxit, bao gồm các hỗn hợp như hỗn hợp Bordeaux (triazit đồng sulfat). “Các thuốc diệt nấm lưu huỳnh” là các hợp chất vô cơ chứa các nhân hoặc mạch của các nguyên tử lưu huỳnh; Ví dụ bao gồm nguyên tố lưu huỳnh. “Các thuốc diệt nấm dithiocarbamat” chứa gốc phân tử dithiocarbamat; Ví dụ bao gồm mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, thiram, zineb và ziram. “Các thuốc diệt nấm phtalimit” chứa gốc phân tử phtalimit; Ví dụ bao gồm folpet, captan và captafol. “Các thuốc diệt nấm clonitril” chứa nhân thion được thế bằng clo và xyano; Ví dụ bao gồm chlorothalonil. “Các thuốc diệt nấm sulfamit” bao gồm dichlofluanid và tolylfluanid. “Các thuốc diệt nấm guanidin” bao gồm dodine, guazatine và iminoctadine. “Các thuốc diệt nấm triazin” bao gồm anilazine. “Các thuốc diệt nấm quinon” bao gồm dithianon.

“Các thuốc diệt nấm không phải là các thuốc diệt nấm hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45); (b46)” bao gồm một số thuốc diệt nấm có chế tác động có thể là chưa biết. Các chất này bao gồm: (b46.1) “các thuốc diệt nấm thiazol carboxamit”

(FRAC mã U5), (b46.2) “các thuốc diệt nấm phenyl-axetamit” (FRAC mã U6), (b46,3) “các thuốc diệt nấm quinazolinon” (FRAC mã U7), (b46.4) “các thuốc diệt nấm benzophenon” (FRAC mã U8) và (b46.5) “các thuốc diệt nấm triazolopyrimidylamin” (FRAC mã 45). Các thiazol carboxamit bao gồm ethaboxam. Các phenyl-axetamit bao gồm cyflufenamid và *N*-[[[(cyclopropylmethoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]-metylen]benzenaxetamit. Các quinazolinon bao gồm proquinazid và 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-on. Các benzophenon bao gồm metrafenone và pyriofenone. Các triazolopyrimidylamin bao gồm ametoctradin và được cho là có tác dụng ức chế sự hô hấp trong ty thể Phức hợp III bằng cách gắn kết với vị trí chưa được làm sáng tỏ trên ubiquinon- reductaza sắc tố tế bào bc1. Nhóm (b46) này còn bao gồm bethoxazin, neo-asozin (sắt (III) metanarsonat), fenpyrazamin, pyrrolnitrin, quinomethionat, tebufloquin, 2-[[2-fluoro-5-(triflometyl)phenyl]thio]-2-[3-(2-metoxypheyl)-2-thiazolidinyliden]axetonitril, 3-[5-(4-clophenyl)-2,3-đimetyl-3-isoxazolidinyl]pyridin, 4-flophenyl *N*-[1-[[[1-(4-xyanophenyl)etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbammat, 5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-metylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin, *N*-(4-clo-2-nitrophenyl)-*N*-etyl-4-metylbenzensulfonamit, *N*-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit và 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-metyletyl)-4-(2-metylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-on.

“Các thuốc diệt nấm không phải là các thuốc diệt nấm thuộc hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45); (b46)” còn bao gồm (b46.5) các hợp chất 6-quinolinyloxyaxetamit có công thức A1 và muối của chúng



trong đó:

R^{a1} là halogen, C_1 – C_4 alkoxy hoặc C_1 – C_4 alkynyl;

Ra² là H, halogen hoặc C₁–C₄ alkyl;

Ra³ là C₁–C₁₂ alkyl, C₁–C₁₂ haloalkyl, C₁–C₁₂ alkoxy, C₂–C₁₂ alkoxyalkyl, C₂–C₁₂ alkenyl, C₂–C₁₂ alkynyl, C₄–C₁₂ alkoxyalkenyl, C₄–C₁₂ alkoxyalkynyl, C₁–C₁₂ alkylthio hoặc C₂–C₁₂ alkylthioalkyl;

Ra⁴ là methyl hoặc Ya¹-Ra⁵;

Ra⁵ là C₁–C₂ alkyl; và

Ya¹ là CH₂, O hoặc S.

Đã biết rộng rãi là các hợp chất có công thức A1, sử dụng chúng làm thuốc diệt nấm và phương pháp điều chế; xem chẳng hạn, các công bố đơn quốc tế WO 2004/047538, WO 2004/108663, WO 2006/058699, WO 2006/058700, WO 2008/110355, WO 2009/030469, WO 2009/049716 và WO 2009/087098. Ví dụ về các hợp chất có công thức A1 bao gồm: 2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-dimethyl-2-butyn-1-yl)-2-(methylthio)axetamit, N-(1,1-dimethyl-2-butyn-1-yl)-2-[(3-etylnyl-6-quinolinyloxy)-2-(methylthio)axetamit, 2-[(3-bromo-8-methyl-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-dimethyl-2-propyn-1-yl)-2-(methylthio)axetamit và 2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-dimethyletyl)butanamit.

“Các thuốc diệt nấm không phải là các thuốc diệt nấm thuộc hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45); (b46)” còn bao gồm (b46.6) N'-[4-[[3-[(4-clophenyl)methyl]-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-dimethylphenyl]-N-etyl-N-methylmetaniminitamit, được cho là có tác dụng ức chế C24-methyl transferaza có liên quan đến sinh tổng hợp sterol.

Trong các phương án của sáng chế, bao gồm các phương án được mô tả sau đây, viện dẫn đến công thức 1 bao gồm N-oxit và muối của chúng trừ khi được quy định khác đi, và viện dẫn đến “hợp chất có công thức 1” bao gồm định nghĩa của các phân tử thể được quy định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi được xác định rõ hơn trong phần các phương án.

Phương án 1: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trong đó trong công thức 1, X là CHOH hoặc NH.

Phương án 2: Chế phẩm theo phương án 1 trong đó X là CHOH.

Phương án 3: Chế phẩm theo phương án 1 trong đó X là NH.

Phương án 4: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 3 trong đó trong công thức 1, R^1 là halogen.

Phương án 5: Chế phẩm theo phương án 4 trong đó R^1 là F, Cl hoặc Br.

Phương án 6: Chế phẩm theo phương án 5 trong đó R^1 là Cl hoặc Br.

Phương án 7: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 6 trong đó trong công thức 1, R^2 là H, xyano, F, Cl, Br hoặc C_1-C_2 alkoxy.

Phương án 8: Chế phẩm theo phương án 7 trong đó R^2 là H, xyano, F, Cl, Br hoặc metoxy.

Phương án 9: Chế phẩm theo phương án 8 trong đó R^2 là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án 10: Chế phẩm theo phương án 9 trong đó R^2 là F hoặc Cl.

Phương án 11: Chế phẩm theo phương án 8 trong đó R^2 là H.

Phương án 12: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 11 trong đó trong công thức 1, R^3 là H hoặc halogen.

Phương án 13: Chế phẩm theo phương án 12 trong đó R^3 là H, F, Cl hoặc Br.

Phương án 14: Chế phẩm theo phương án 13 trong đó R^3 là H, F hoặc Cl.

Phương án 15: Chế phẩm theo phương án 14 trong đó R^3 là H hoặc F.

Phương án 16: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 11 trong đó trong công thức 1, R^3 là halogen hoặc metyl.

Phương án 17: Chế phẩm theo phương án 16 trong đó R^3 là halogen.

Phương án 18: Chế phẩm theo phương án 17 trong đó R^3 là F, Cl hoặc Br.

Phương án 19: Chế phẩm theo phương án 14 hoặc 18 trong đó R^3 là F hoặc Cl.

Phương án 20: Chế phẩm theo phương án 15 hoặc 19 trong đó R^3 là F.

Phương án 21: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 20 trong đó trong công thức 1, R^4 là F, Cl hoặc Br.

Phương án 22: Chế phẩm theo phương án 21 trong đó R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án 23: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 22 trong đó trong công thức 1, R^5 là H, xyano, F, Cl, Br hoặc C_1-C_2 alkoxy.

Phương án 24: Chế phẩm theo phương án 23 trong đó R^5 là H, xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án 25: Chế phẩm theo phương án 24 trong đó R^5 là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án 26: Chế phẩm theo phương án 25 trong đó R^5 là xyano hoặc F.

Phương án 27: Chế phẩm theo phương án 26 trong đó R^5 là xyano.

Phương án 28: Chế phẩm theo phương án 26 trong đó R^5 là F.

Phương án 29: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 28 trong đó trong công thức 1, R^6 là H, F, Cl hoặc Br.

Phương án 30: Chế phẩm theo phương án 29 trong đó R^6 là H hoặc F.

Phương án 31: Chế phẩm theo phương án 30 trong đó R^6 là H.

Phương án 32: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 31 trong đó trong công thức 1, nhiều nhất, chỉ một trong số R^2 và R^3 là H (tức là chỉ một trong số R^2 và R^3 là H, hoặc không có gốc nào R^2 hoặc R^3 là H).

Phương án 33: Chế phẩm theo phương án 32 trong đó R^3 là H (và R^2 không phải là H).

Phương án 34: Chế phẩm theo phương án 32 trong đó R^2 là H (và R^3 không phải là H).

Phương án 35: Chế phẩm theo phương án 32 trong đó cả hai R^2 và R^3 không phải là H.

Phương án 36: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 35 trong đó trong công thức 1, nhiều nhất, chỉ một trong số R^5 và R^6 là H (tức là chỉ một trong số R^5 và R^6 là H, hoặc neither R^5 nor R^6 là H).

Phương án 37: Chế phẩm theo phương án 36 trong đó R^6 là H (và R^5 không phải là H).

Phương án 38: Chế phẩm theo phương án 36 trong đó R^5 là H (và R^6 không phải là H).

Phương án 39: Chế phẩm theo phương án 36 trong đó cả hai R^5 và R^6 không phải là H.

Phương án 40: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 39 trong đó trong công thức 1, nhiều nhất, chỉ hai trong số R^2 , R^3 , R^4 và R^6 là H.

Phương án 41: Chế phẩm theo phương án 40 trong đó hai trong số R^2 , R^3 , R^4 và R^6 là H.

Phương án 42: Chế phẩm theo phương án 40 trong đó, nhiều nhất, chỉ một trong số R^2 , R^3 , R^4 và R^6 là H.

Phương án 43: Chế phẩm theo phương án 42 trong đó một trong số R^2 , R^3 , R^4 và R^6 là H.

Phương án 44: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 43 trong đó hợp phần (a) không chứa *N*-oxit của hợp chất có công thức 1.

Phương án 45: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 44 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm:

N,4-bis(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 47),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 143),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2-bromo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 195),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 144),

N-(4-clo-2,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 81),

4-[5-[(4-clo-2-flophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 40),

N-(2-clo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 82),

4-[5-[(2-clo-4,6-điflophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-flobenzonitril (Hợp chất 238),

4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 13),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,4-điclo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 136),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-điflo-4-metoxyphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 3),

4-(2-clo-4-flophenyl)- α -(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 122),

N-(2,4-điclo-6-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 161),

4-(2,4-điclophenyl)-*N*-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 17),

4-(2,6-điflo-4-metoxyphenyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 7),

4-[[1,3-đimetyl-4-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 8),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 239),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 240),

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 241),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 244),

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 245),

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 247),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-flo-6-metylphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 252),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-metylphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 253),

N-(2-bromo-6-metylphenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 254),

N-(2-clo-6-metylphenyl)-4-(2-flo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 257),

N-(2-bromo-6-metylphenyl)-4-(2-flo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 258),

4-(2-flo-4-metoxyphephenyl)-*N*-(2-flo-6-metylphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 259),

N-(2-clo-6-flophenyl)-4-(2-flo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 260),

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-flo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 261),

4-(2-clo-4-metoxyphephenyl)-*N*-(2-clo-6-metylphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 262),

N-(2-bromo-6-methylphenyl)-4-(2-clo-4-metoxyphe-nyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 263),

N-(2-bromo-6-methylphenyl)-4-(2-clo-4-metoxyphe-nyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 264),

N-(2-bromo-6-methylphenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 265),

4-(2-bromo-4-flopheny)-*N*-(2-bromo-6-methylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 266),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-flo-6-methylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 267),

4-(2,4-điflophenyl)-*N*-(2-flo-6-methylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 268),

N-(2-clo-6-methylphenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 269),

4-(2,4-điflophenyl)-*N*-(2,6-dimetylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 270),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-dimetylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 271),

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-metoxyphe-nyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 273),

N-(2-clo-6-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 275), và

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-methylphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 276).

(với điều kiện là các hợp chất của các nhóm nằm trong phạm vi của phương án gốc).

Phương án 46: Chế phẩm theo phương án 45 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm các hợp chất 3, 7, 8, 13, 17, 40, 47, 81, 82, 122, 136, 143, 144, 161, 195, 238, 239, 240 và 241.

Phương án 47: Chế phẩm theo phương án 46 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm các hợp chất 3, 7, 8, 13, 17, 40, 47, 81, 82, 122, 136, 143, 144, 161, 195 và 238.

Phương án 48: Chế phẩm theo phương án 45 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm các hợp chất 239, 240, 241, 244, 245, 247, 252, 253, 254, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 273, 275 và 276.

Phương án 49: Chế phẩm theo phương án 48 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm các hợp chất 239, 240 và 241.

Phương án 50: Chế phẩm theo phương án 45 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm Hợp chất 195 và Hợp chất 238.

Phương án 51: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 50, với điều kiện là khi hợp phần (a) bao gồm hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm

4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 4),

4-(2,6-điflo-4-metoxyphenyl)-*N*-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 6),

4-(2,6-điflo-4-metoxyphenyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 7),

4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 11),

4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-
3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 13),

4-[[4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-flobenzonitril
(Hợp chất 130),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 46),

4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-flobenzonitril
(Hợp chất 33),

3-clo-4-[[4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitril
(Hợp chất 127),

4-(2-clo-4-flophenyl)- α -(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol
(Hợp chất 122),

N,4-bis(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 47),

N-(2-clo-4-flophenyl)-4-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 58),

N-(2-clo-4,6-điflophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 86),

N-(2-clo-4,6-điflophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 117),

N-(4-clo-2,6-điflophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 121),

N-(4-clo-2,6-điflophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin
(Hợp chất 126),

3-clo-4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitril
(Hợp chất 37),

4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]amino]-3,5-điflo-benzonitril (Hợp chất 25),

N-(2-clo-4-flophenyl)-4-(2,6-điflo-4-metoxyphenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 23),

α ,4-bis(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 123),

N-(4-clo-2,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 81),

N-(2-clo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 82),

N-(2,6-điclo-4-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 137),

3-clo-4-[5-[(2-clo-4,6-điflophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitril (Hợp chất 108),

3-clo-4-[5-[(4-clo-2,6-điflophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitril (Hợp chất 111),

N-(2-bromo-4-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 118),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,4-điclo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 136),

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-điclo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 138),

4-[[4-(2-bromo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-flobenzonitril (Hợp chất 79),

N-(2-bromo-4-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 73),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 74),

N-(4-bromo-2,6-điflophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 133),

4-[[4-(2-bromo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflo-benzonitril (Hợp chất 65),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-4,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 84),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(4-clo-2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 129),

N-(4-bromo-2,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 134),

3-bromo-4-[[4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitril (Hợp chất 139),

3-clo-4-[[4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitril (Hợp chất 140),

N-(2,4-điclo-6-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 141),

N-(2,6-điclo-4-flophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 142),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 143),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 144),

N-(4-bromo-2,6-điflophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 145),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2,6-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 146),

N-(2-bromo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 147),

α -(4-clo-2,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 148),

4-[5-[(2-clo-4,6-điflophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-flobenzonitril (Hợp chất 238),

4-[5-[(4-clo-2,6-điflophenyl)amino]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-flobenzonitril (Hợp chất 150),

α -(2-clo-4,6-điflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 151),

α -(2-bromo-4-flophenyl)-4-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 152), và

α -(2-bromo-4-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 153),

thì hợp phần (b) chứa ít nhất hai hợp chất diệt nấm, và

(1) khi hợp phần (b) cấu thành từ kết hợp kép của hai hợp chất diệt nấm, trong đó một trong số các hợp chất diệt nấm là cyproconazole, difenconazole, epoxiconazole, metconazole, myclobutanil, prothioconazole hoặc tebuconazole thì hợp chất diệt nấm kia không phải là azoxystrobin, bixafen, boscalid, cyflufenamid, fluopyram, isopyrazam, kresoxim-metyl, metrafenone, penthiopyrad, picoxystrobin, proquinazid, pyraclostrobin, quinoxifen, sedaxane hoặc trifloxystrobin, và

(2) khi hợp phần (b) cấu thành từ kết hợp ba gồm ba hợp chất diệt nấm, trong đó một trong số các hợp chất diệt nấm là cyproconazole, difenconazole, epoxiconazole, metconazole, myclobutanil, prothioconazole hoặc tebuconazole, và

hợp chất diệt nấm khác là picoxystrobin hoặc trifloxystrobin, thì hợp chất diệt nấm thứ ba không phải là proquinazid.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–51 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong bản mô tả này, có thể được kết hợp với nhau theo cách thức bất kỳ, và phần mô tả các biến trong các phương án không chỉ liên quan đến chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 với ít nhất một hợp chất diệt nấm khác mà còn liên quan đến chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 với ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống, và còn liên quan đến hợp chất có công thức 1 và chế phẩm của chúng, và cũng như các hợp chất là nguyên liệu và các hợp chất trung gian hữu ích để điều chế các hợp chất có công thức 1. Ngoài ra, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–51 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong bản mô tả này, và kết hợp bất kỳ của chúng, thuộc vào các phương pháp của sáng chế. Do đó đáng lưu ý như là một phương án nữa là chế phẩm được bộc lộ nêu trên chứa (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1 đã nêu trên, *N*-oxit, và muối của chúng; và ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống, với điều kiện là khi hợp phần (a) cấu thành từ hợp chất được chọn từ nhóm được liệt kê trong phương án 51, thì chế phẩm này chứa ít nhất hai hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống, hoặc ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung (tức là hợp chất diệt nấm ngoài hợp chất có công thức 1).

Kết hợp của các phương án 1–51 được minh họa như sau:

Phương án A1: Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trong đó hợp phần (a) là hợp chất có công thức 1 hoặc muối của chúng, trong đó trong công thức 1,

hiều nhất, chỉ một trong số R^2 và R^3 là H; và

hiều nhất, chỉ một trong số R^5 và R^6 là H.

Phương án A2: Chế phẩm theo phương án A1 trong đó trong công thức 1,

R^1 là F, Cl hoặc Br;

R^2 là H, xyano, F, Cl, Br hoặc metoxy;

R^3 là H, F hoặc Cl;

R^4 là F, Cl hoặc Br;

R^5 là H, xyano, F, Cl hoặc metoxy; và

R^6 là H hoặc F.

Phương án A3: Chế phẩm theo phương án A2 trong đó trong công thức 1,

R^3 là H hoặc F; và

R^5 là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án A4 : Chế phẩm theo phương án A3 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm: Hợp chất 3, Hợp chất 7, Hợp chất 8, Hợp chất 13, Hợp chất 17, Hợp chất 40, Hợp chất 47, Hợp chất 81, Hợp chất 82, Hợp chất 122, Hợp chất 136, Hợp chất 143, Hợp chất 144, Hợp chất 161, Hợp chất 195, Hợp chất 238, Hợp chất 239, Hợp chất 240 và Hợp chất 241.

Phương án A5 : Chế phẩm theo phương án A4 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm: Hợp chất 3, Hợp chất 7, Hợp chất 8, Hợp chất 13, Hợp chất 17, Hợp chất 40, Hợp chất 47, Hợp chất 81, Hợp chất 82, Hợp chất 122, Hợp chất 136, Hợp chất 143, Hợp chất 144, Hợp chất 161, Hợp chất 195 và Hợp chất 238.

Phương án A6 : Chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trong đó hợp phần (a) là hợp chất có công thức 1 hoặc muối của chúng, trong đó trong công thức 1,

X là NH;

R^1 là halogen hoặc metyl;

R^2 là H;

R^3 là halogen hoặc metyl;

R^4 là halogen;

R^5 là H, xyano, halogen hoặc C_1-C_2 alkoxy; và

R^6 là H hoặc halogen;

với điều kiện là khi R^1 là F, thì R^3 là Cl, và khi R^1 là Cl, thì R^3 là F.

Phương án A7: Chế phẩm theo phương án A6 trong đó trong công thức 1,

R^3 là F hoặc Cl.

Phương án A8: Chế phẩm theo phương án A7 trong đó trong công thức 1,

R^1 là Cl hoặc Br; và

R^3 là F.

Phương án A9: Chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ A6 đến A8 trong đó trong công thức 1, nhiều nhất, chỉ một trong số R^5 và R^6 là H.

Phương án A10: Chế phẩm theo phương án A9 trong đó trong công thức 1,

R^4 là F, Cl hoặc Br;

R^5 là H, xyano, F, Cl hoặc metoxy; và

R^6 là H hoặc F.

Phương án A11: Chế phẩm theo phương án A10 trong đó trong công thức 1,

R^5 là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án A12: Chế phẩm theo phương án A6 trong đó hợp phần (a) là hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm: Hợp chất 239, Hợp chất 240, và Hợp chất 241.

Phương án B1: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít

nhất một hợp chất được chọn từ (b1) các thuốc diệt nấm methyl benzimidazole carbamat chẳng hạn như benomyl, carbendazim và thiophanate-methyl.

Phương án B2: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b2) các thuốc diệt nấm đicarboximit chẳng hạn như procymidone, iprodione và vinclozolin.

Phương án B3: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b3) các thuốc diệt nấm là chất ức chế khử methyl chẳng hạn như epoxiconazole, fluquinconazole, triadimenol, simeconazole, ipconazole, triforine, cyproconazole, difenconazole, flusilazole, flutriafol, metconazole, myclobutanil, prochloraz, propiconazole, prothioconazole, tebuconazole và tetraconazole.

Phương án B4: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b4) các thuốc diệt nấm phenylamit chẳng hạn như metalaxyl, metalaxyl-M, benalaxyl, benalaxyl-M, furalaxyl, ofurace và oxadixyl.

Phương án B5: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b5) các thuốc diệt nấm amin/morpholin chẳng hạn như aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph, trimorphamide, fenpropidin, piperalin và spiroxamin.

Phương án B6: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ

trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b6) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp phospholipit chẳng hạn như edifenphos và isoprothiolane.

Phương án B7: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b7) các thuốc diệt nấm carboxamit chẳng hạn như bixafen, boscalid, carboxin, isopyrazam, oxycarboxin, penflufen và penthiopyrad.

Phương án B8: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b8) các thuốc diệt nấm hydroxy(2-amino-)pyrimidin chẳng hạn như ethirimol.

Phương án B9: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b9) các thuốc diệt nấm anilinopyrimidin chẳng hạn như cyprodinil.

Phương án B10: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b10) các thuốc diệt nấm *N*-phenyl carbamat chẳng hạn như diethofencarb.

Phương án B11: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b11) các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon chẳng hạn như azoxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, kresoxim-

metyl, trifloxystrobin, picoxystrobin, pyraoxystrobin, pyribencarb, famoxadone, fenamidone, discostrobin, enestrobin, dimoxystrobin, metominostrobin, orysastrobin và fluoxastrobin.

Phương án B12: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b12) các hợp chất diệt nấm phenylpyrol chẳng hạn như fenpiclonil và fludioxonil.

Phương án B13: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b13) các thuốc diệt nấm quinolin chẳng hạn như quinoxifen.

Phương án B14: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b14) các thuốc diệt nấm là chất ức chế quá trình peroxy hóa của lipid chẳng hạn như chloroneb.

Phương án B15: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b15) các thuốc diệt nấm chất ức chế sinh tổng hợp melanin-reductaza chẳng hạn như pyroquilon và tricyclazole.

Phương án B16: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b16) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-dehydrataza chẳng hạn như carpropamid.

Phương án B17: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b17) các thuốc diệt nấm hydroxyanilit chẳng hạn như fenhexamid.

Phương án B18: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b18) các thuốc diệt nấm là chất ức chế squalen-epoxidaza chẳng hạn như pyributicarb.

Phương án B19: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b19) các thuốc diệt nấm polyoxin chẳng hạn như polyoxin.

Phương án B20: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b20) các thuốc diệt nấm phenylure chẳng hạn như pencycuron.

Phương án B21: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b21) các thuốc diệt nấm là chất ức chế ở vị trí bên trong quinon chẳng hạn như cyazofamid và amisulbrom.

Phương án B22: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít

nhất một hợp chất được chọn từ (b22) các thuốc diệt nấm benzamide chẳng hạn như zoxamide.

Phương án B23: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b23) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh là axit enopyranuronic chẳng hạn như blasticidin-S.

Phương án B24: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b24) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh hexopyranosyl chẳng hạn như kasugamycin.

Phương án B25: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b25) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế tổng hợp protein chẳng hạn như streptomycin.

Phương án B26: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b26) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế sinh tổng hợp trehalaza và inositol chẳng hạn như validamycin.

Phương án B27: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b27) xyanoaxetylmitoxim các thuốc diệt nấm chẳng hạn như cymoxanil.

Phương án B28: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b28) các thuốc diệt nấm carbamat chẳng hạn như propamocarb, prothiocarb và iodocarb.

Phương án B29: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b29) các thuốc diệt nấm làm mất kết hợp quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa chẳng hạn như fluazinam, binapacryl, ferimzone, mepyldinocap và dinocap.

Phương án B30: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b30) các thuốc diệt nấm là hợp chất thiếc hữu cơ chẳng hạn như fentin axetat.

Phương án B31: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b31) các thuốc diệt nấm là axit carboxylic chẳng hạn như oxolinic axit.

Phương án B32: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b32) các thuốc diệt nấm dị vòng thơm chẳng hạn như hymexazole.

Phương án B33: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ

trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b33) các thuốc diệt nấm phosphonat chẳng hạn như axit phosphorơ và các muối khác nhau của nó, bao gồm fosetyl-nhôm.

Phương án B34: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b34) các thuốc diệt nấm axit phtalamic chẳng hạn như teclofthalam.

Phương án B35: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b35) các thuốc diệt nấm benzotriazin chẳng hạn như triazoxide.

Phương án B36: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b36) các thuốc diệt nấm benzen-sulfonamit chẳng hạn như flusulfamide.

Phương án B37: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b37) các thuốc diệt nấm pyridazinon chẳng hạn như diclomezine.

Phương án B38: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b38) các thuốc diệt nấm thiophen-carboxamit chẳng hạn như silthiofam.

Phương án B39: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b39) các thuốc diệt nấm pyrimidinamit chẳng hạn như diflumetorim.

Phương án B40: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b40) các thuốc diệt nấm amit của axit carboxylic chẳng hạn như dimethomorph, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, iprovalicarb, valifenalate, mandipropamid và flumorph.

Phương án B41: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b41) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh tetracyclin chẳng hạn như oxytetracyclin.

Phương án B42: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b42) các thuốc diệt nấm thiocarbamat chẳng hạn như methasulfocarb.

Phương án B43: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b43) các thuốc diệt nấm benzamide chẳng hạn như fluopicolide và fluopyram.

Phương án B44: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ

trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b44) các thuốc diệt nấm cảm ứng cơ chế phòng vệ của thực vật chủ chẳng hạn như acibenzolar-*S*-metyl.

Phương án B45: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b45) các thuốc diệt nấm tiếp xúc đa vị trí chẳng hạn như đồng oxyclozua, đồng sulfat, đồng hydroxit, chế phẩm Bordeaux (triazit đồng sulfua), đơn chất lưu huỳnh, mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, thiram, zineb, ziram, folpet, captan, captafol và chlorothalonil.

Phương án B46: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ (b46) các thuốc diệt nấm không phải là các thuốc diệt nấm của hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45), chẳng hạn như ethaboxam, cyflufenamid, proquinazid, metrafenone, pyriofenone, ametoctradin, bethoxazin, neo-asozin, fenpyrazamin, pyrrolnitrin, quinomethionate, tebufloquin, 5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-metylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin (BAS600), 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-on, 3-[5-(4-clophenyl)-2,3-đimetyl-3-isoxazolidinyl]pyridin (SYP-Z048), 4-flophenyl *N*-[1-[[[1-(4-xyanophenyl)etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbamit (XR-539), *N*-[[[(xyclopropylmetoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]metylen]benzenaxetamit, *N'*-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimamit, 2-[[2-flo-5-(triflometyl)phenyl]thio]-2-[3-(2-metoxyphephenyl)-2-thiazolidinyliden]axetonitril (OK-5203), *N*-(4-clo-2-nitrophenyl)-*N*-etyl-4-metylbenzensulfonamit (TF-991) và 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-metyletyl)-4-(2-metylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-on.

Phương án B47: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít

nhất một hợp chất diệt nấm (chất diệt nấm) được chọn từ nhóm bao gồm azoxystrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, pyraoxystrobin, pyrametostrobin, picoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, carbendazim, chlorothalonil, quinoxifen, metrafenone, pyriofenone, cyflufenamid, fenpropidin, fenpropimorph, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, flusilazole, hexaconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, tebuconazole, triticonazole, famoxadone, prochloraz, penthiopyrad và boscalid (nicobifen).

Phương án B48: Chế phẩm theo phương án B47 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm azoxystrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, picoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, quinoxifen, metrafenone, pyriofenone, cyflufenamid, fenpropidin, fenpropimorph, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, flusilazole, metconazole, myclobutanil, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, tebuconazole, triticonazole, famoxadone và penthiopyrad.

Phương án B49: Chế phẩm như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (bao gồm nhưng không chỉ giới hạn trong số chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 và A1 đến A12) trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ các hợp chất có công thức A1 và muối của chúng, trong đó Công thức A1 và các phân tử thể trên đó là như được bộc lộ trong bản mô tả này cho nhóm hợp chất (b46.5) 6-quinolinyloxyaxetamit.

Phương án B50: Chế phẩm theo phương án B49 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm 2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-đimetyl-2-butyln-1-yl)-2-(metylthio)axetamit, N-(1,1-đimetyl-2-butyln-1-yl)-2-[(3-etylnyl-6-quinolinyloxy)-2-(metylthio)axetamit, 2-[(3-bromo-8-metyl-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-đimetyl-2-propyln-1-yl)-2-(metylthio)axetamit và 2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)-N-(1,1-đimetyletyl)butanamit.

Đáng lưu ý là chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án được mô tả trong bản mô tả này, bao gồm các phương án 1 đến 51, A1 đến A12, và B1 đến B50, trong đó tham khảo đến công thức 1 bao gồm muối của chúng nhưng không phải đề cập đến *N*-oxit của chúng; do đó cụm từ “hợp chất có công thức 1” có thể được thay bằng cụm từ “hợp chất có công thức 1 hoặc muối của nó”. Trong chế phẩm đáng lưu ý này, hợp phần (a) là hợp chất có công thức 1 hoặc muối của nó.

Cũng đáng lưu ý là các phương án là chế phẩm diệt nấm theo sáng chế chứa chế phẩm theo các phương án từ 1 đến 51, từ A1 đến A12, và B1 đến B50 với một lượng hữu hiệu diệt nấm và ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng.

Các phương án theo sáng chế còn bao gồm các phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó, hoặc lên hạt giống thực vật hoặc cây con, chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51, A1 đến A12, và B1 đến B50 (ví dụ, chế phẩm bao gồm các hợp phần chế phẩm như mô tả trong bản mô tả này) với một lượng hữu hiệu diệt nấm. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51, A1 đến A12, và B1 đến B50 với một lượng hữu hiệu diệt nấm lên thực vật hoặc hạt giống thực vật.

Một số các phương án theo sáng chế liên quan đến việc phòng trừ bệnh cho thực vật hoặc bảo vệ thực vật khỏi bệnh mà chủ yếu tác động tới lá thực vật và/hoặc đưa chế phẩm theo sáng chế lên lá thực vật (tức là lên cây thay vì lên hạt giống). Các phương pháp sử dụng được ưu tiên bao gồm các phương pháp liên quan đến các chế phẩm được ưu tiên nêu trên; và các bệnh này được phòng trừ với hiệu quả nhất định bao gồm các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra. Việc dùng kết hợp các thuốc diệt nấm theo sáng chế có thể tạo thuận lợi cho việc phòng trừ bệnh và làm chậm sự phát triển tính kháng thuốc.

Các phương án của các phương pháp còn bao gồm:

Phương án C1: Phương pháp bảo vệ thực vật khỏi bệnh được chọn từ các bệnh phần trắng, bệnh gỉ sắt và *Septoria* bao gồm việc đưa một lượng hữu hiệu diệt nấm của chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế hoặc theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 51 lên thực vật.

Phương án C2: Phương pháp theo phương án C1 trong đó bệnh này là bệnh phần trắng và hợp phần (b) của chế phẩm bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ (b4) các thuốc diệt nấm là chất ức chế khử metyl (DMI), (b11) các thuốc diệt nấm chất ức chế vị trí bên ngoài quinolin (QoI), và (b46.4) proquinazid.

Phương án C3: Phương pháp theo phương án C2 trong đó bệnh này là bệnh phần trắng cây lúa mì.

Phương án C4: Phương pháp theo phương án C2 hoặc C3 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ (b4) các thuốc diệt nấm DMI.

Phương án C5: Phương pháp theo phương án C4 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, myclobutanil, prothioconazole và tetraconazole.

Phương án C6: Phương pháp theo phương án C5 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm cyproconazole, difenoconazole và prothioconazole.

Phương án C7: Phương pháp theo phương án C2 hoặc C3 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ (b11) các thuốc diệt nấm QoI.

Phương án C8. Phương pháp theo phương án C7 trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm azoxystrobin, picoxystrobin và pyraclostrobin.

Phương án C9: Phương pháp theo phương án C2 hoặc C3 trong đó hợp phần (b) bao gồm (b46.4) proquinazid.

Phương án C10: Phương pháp theo phương án C1 trong đó bệnh này là bệnh gỉ sắt và hợp phần (b) là chế phẩm bao gồm fenpropimorph.

Phương án C11: Phương pháp theo phương án C10 trong đó bệnh này là bệnh gỉ sắt lá cây lúa mì.

Phương án C12: Phương pháp theo phương án C1 trong đó bệnh này là bệnh *Septoria* và hợp phần (b) của chế phẩm bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm epoxiconazole, metalaxyl (bao gồm metalaxyl-M), iprovalicarb và fenpropimorph.

Phương án C13: Phương pháp theo phương án C12 trong đó bệnh này là bệnh đốm lá lúa mì.

Phương án C14: Phương pháp bảo vệ thực vật khỏi bệnh *Septoria* bao gồm việc đưa chế phẩm theo phương án B49 hoặc B50 với một lượng hữu hiệu diệt nấm lên thực vật.

Phương án C15: Phương pháp theo phương án C14 trong đó bệnh này là do *Septoria tritici* gây ra.

Phương án C16: Phương pháp theo phương án C14 hoặc C15 trong đó bệnh này là bệnh đốm lá lúa mì.

Phương án C17: Phương pháp theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ C1 đến C16 trong đó hợp phần (a) và (b) được dùng với với lượng hữu hiệu có hiệu quả hiệp đồng (và với tỷ lệ hiệp đồng so với nhau).

Đáng lưu ý là các phương án là các phần của các phương án C1 đến C17 liên quan đến phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó, chế phẩm diệt nấm theo sáng chế với một lượng hữu hiệu diệt nấm.

Như được đề cập đến trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, sáng chế còn đề xuất hợp chất có công thức 1, hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng. Cũng đã được lưu ý nhắc đến là các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–51, đề cập đến các hợp chất có công thức 1. Theo đó kết hợp của các phương án 1–51 còn được thể hiện bằng:

Phương án D1: A hợp chất có công thức 1, hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng, trong đó:

X là NH;

R¹ là halogen hoặc methyl;

R² là H;

R³ là halogen hoặc methyl;

R⁴ là halogen;

R⁵ là H, xyano, halogen hoặc C₁–C₂ alkoxy; và

R⁶ là H hoặc halogen;

với điều kiện là khi R¹ là F, thì R³ là Cl, và khi R¹ là Cl, thì R³ là F.

Phương án D2. Hợp chất theo phương án D1 trong đó

R³ là F hoặc Cl.

Phương án D3. Hợp chất theo phương án D2 trong đó

R¹ là Cl hoặc Br; và

R³ là F.

Phương án D4. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ D1 đến D4 trong đó, nhiều nhất, chỉ một trong số R⁵ và R⁶ là H.

Phương án D5: Hợp chất theo phương án D4 trong đó:

R⁴ là F, Cl hoặc Br;

R⁵ là H, xyano, F, Cl hoặc metoxy; và

R⁶ là H hoặc F.

Phương án D6: Hợp chất theo phương án D5 trong đó:

R⁵ là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

Phương án D7: Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ D1 đến D6 trong đó hợp chất này không phải là ở dạng *N*-oxit (tức là ở dạng Công thức 1 hoặc muối của chúng).

Phương án D8: Hợp chất theo phương án D1 được chọn từ nhóm bao gồm:

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 239),

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5 amin (Hợp chất 240), và

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 241).

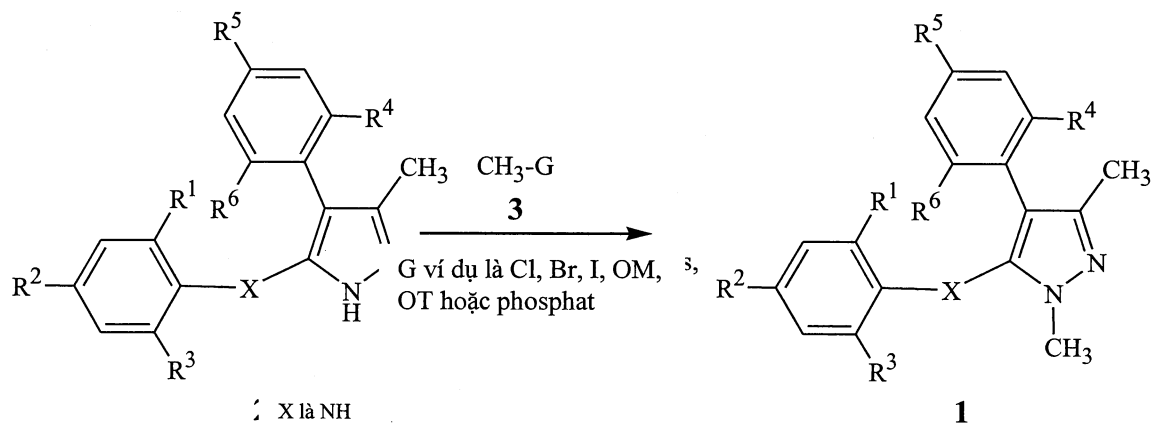
Các phương án bổ sung bao gồm chế phẩm diệt nấm chứa: (1) hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ D1 đến D8; và (2) ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng. Các phương án bổ sung còn bao gồm phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa một lượng hữu hiệu diệt nấm của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ D1 đến D8 lên thực vật (hoặc bộ phận của nó) hoặc hạt giống thực vật (trực tiếp hoặc thông qua môi trường (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của thực vật hoặc hạt giống thực vật). Đáng lưu ý là các phương án liên quan đến phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó, hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ D1 đến D8 với một lượng hữu hiệu diệt nấm.

Có thể sử dụng một hoặc nhiều phương pháp sau đây và các phương pháp biến đổi như được mô tả trong các Sơ đồ 1–17 để điều chế hợp chất có công thức 1. Định nghĩa của R¹, R², R³, R⁴, R⁵ và R⁶ trong các hợp chất có công thức 1–26 sau đây là như được xác định ở trên trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi được quy định khác đi. Công thức 1a và 1b là các tập con khác nhau của công thức 1; Công thức

4a và 4b là các tập con khác nhau của công thức 4; Công thức 6a và 6b là các tập con khác nhau của công thức 6; Công thức 11a là tập con của công thức 11; và Công thức 23a là tập con của công thức 23. Các phân tử thể cho mỗi công thức tập con là như được xác định cho công thức gốc của nó trừ khi được quy định khác đi.

Như được thể hiện trên sơ đồ 1, có thể điều chế hợp chất có công thức 1 trong đó X là NH bằng cách cho các hợp chất 1*H*-pyrazol có công thức 2 phản ứng với các tác nhân methyl hóa khác nhau (ví dụ, Công thức 3), như iodometan, methyl sulfonat (ví dụ, methyl mesylat (OM) hoặc tosylat (OT)) hoặc trimethyl phosphat, tốt hơn nếu với sự có mặt của bazơ hữu cơ hoặc vô cơ chẳng hạn như 1,8-điazabicyclo[5.4.0]undec-7-en, kali cacbonat hoặc kali hydroxit, và trong dung môi chẳng hạn như *N,N*-dimethylformamit (DMF), tetrahydrofuran (THF), toluen hoặc nước.

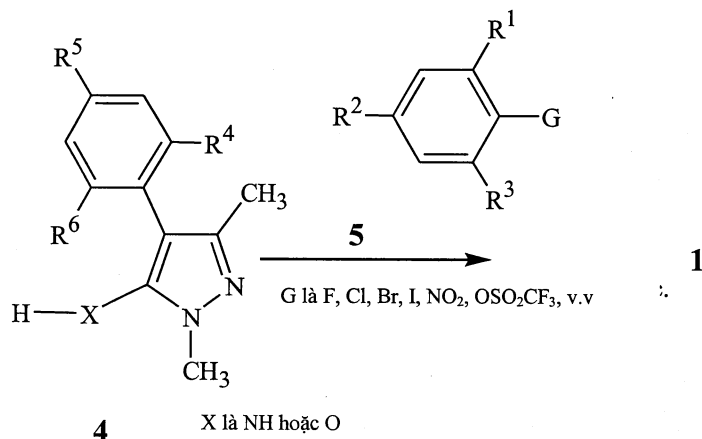
Sơ đồ 1



Như được thể hiện trên sơ đồ 2, có thể điều chế hợp chất có công thức 1 bằng cách cho các hợp chất có công thức 4 (tức là 5-aminopyrazol với X là NH, hoặc 5-hydroxypyrazol (5-pyrazolon) với X là O, phản ứng với các hợp chất thơm có công thức 5 chứa nhóm rời chuyển G (tức là halogen hoặc (halo)alkylsulfonat), tùy ý với sự có mặt của kim loại chất xúc tác, và thường với sự có mặt của bazơ và dung môi không proton có cực chẳng hạn như *N,N*-dimethylformamit hoặc dimethyl sulfoxit. Ví dụ, hợp chất có công thức 5 trong đó benzen nhân chứa các phân tử thể hút điện tử phản ứng bằng cách thay thế trực tiếp nhóm rời chuyển G từ nhân để tạo ra hợp chất có công thức 1. Phương pháp theo Sơ đồ 2 được thể hiện bằng bước D của ví dụ tổng

hợp 6. Các hợp chất có công thức 5 là có sẵn trên thị trường hoặc phương pháp điều chế chúng là đã biết đến trong lĩnh vực kỹ thuật này.

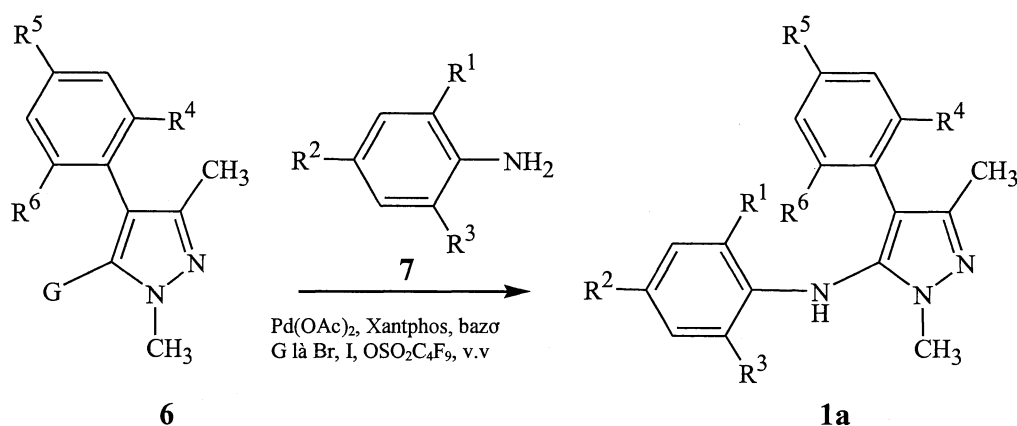
Sơ đồ 2



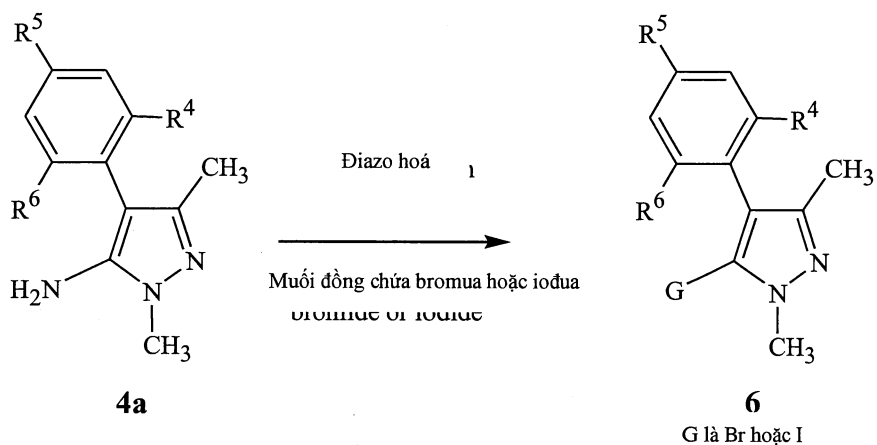
Đối với các phản ứng theo phương pháp nêu ở Sơ đồ 2 giữa hợp chất có công thức 4 trong đó X là O hoặc NH với hợp chất có công thức 5 trong đó nhân thơm thiếu các phân tử thế hút điện tử đủ mạnh, hoặc để cải thiện tốc độ phản ứng, hiệu suất hoặc độ tinh khiết sản phẩm, việc sử dụng chất xúc tác kim loại (ví dụ, kim loại hoặc muối của kim loại) với lượng nằm trong khoảng từ lượng xúc tác đến lượng siêu hệ số tỷ lượng có thể tạo thuận lợi cho phản ứng mong muốn. Thông thường đối với các điều kiện này, G là Br hoặc I hoặc sulfonat chẳng hạn như $OS(O)_2CF_3$ hoặc $OS(O)_2(CF_2)_3CF_3$. Ví dụ, có thể sử dụng các phức hợp của muối đồng (ví dụ, CuI với *N,N*-đimethyletylendiamin, prolin hoặc bipyridyl), các phức hợp paladi (ví dụ, tris-(đibenzylidenaxeton)đipaladi(0)) hoặc các muối paladi (ví dụ, paladi axetat) với các phối tử chẳng hạn như 4,5-bis(điphenylphosphino)-9,9-đimetylxanten (tức là “Xantphos”), 2-đixyclohexylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl (tức là “Xphos”) hoặc 2,2'-bis(điphenylphosphino)-1,1'-binaphtalen (tức là “BINAP”), với sự có mặt của bazơ chẳng hạn như kali cacbonat, xesi cacbonat, natri phenoxit hoặc natri *tert*-butoxit, trong dung môi chẳng hạn như *N,N*-đimetylformamit, 1,2-đimetoxyetan, đimetyl sulfoxit, 1,4-đioxan hoặc toluen, tùy ý được trộn với rượu chẳng hạn như etanol. Theo cách khác như được minh họa trên Sơ đồ 3, có thể điều chế hợp chất có công thức 1a (tức là Công thức 1 trong đó X là NH) bằng cách cho các hợp chất có

công thức 6 (tức là 5-bromopyrazol hoặc các pyrazol khác được thế ở vị trí 5 bằng nhóm rời chuyển) phản ứng với các hợp chất có công thức 7 trong điều kiện được xúc tác bằng kim loại tương tự với điều kiện đã nêu trên cho Sơ đồ 2. Phương pháp theo Sơ đồ 3 được thể hiện bằng bước C của ví dụ tổng hợp 1 và bước E của ví dụ tổng hợp 2. Hợp chất có công thức 7 là có sẵn trên thị trường hoặc phương pháp điều chế chúng là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

Sơ đồ 3



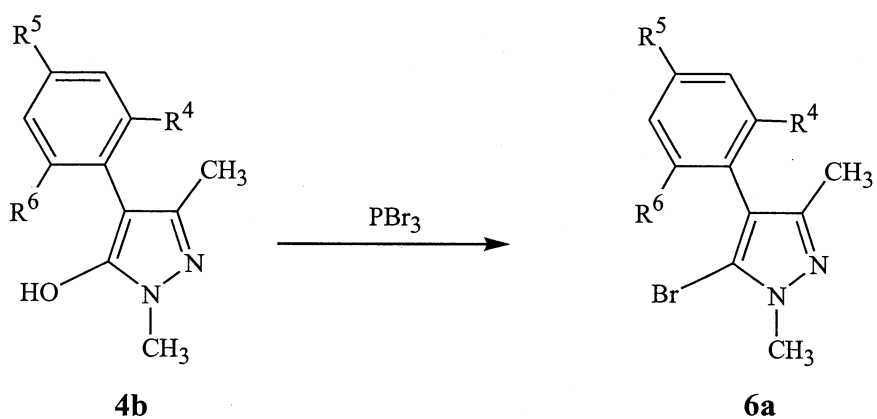
Như được thể hiện trên sơ đồ 4, có thể điều chế các hợp chất có công thức 6 trong đó G là Br hoặc I bằng cách cho 5-aminopyrazol có công thức 4a (tức là Công thức 4 trong đó X là NH) phản ứng trong điều kiện diazo hóa hoặc với sự có mặt của, hoặc sau đó khi kết hợp với, các muối bromua hoặc iotua của đồng. Ví dụ, việc bổ sung *tert*-butyl nitrit vào dung dịch 5-aminopyrazol có công thức 4a với sự có mặt của CuBr_2 trong dung môi chẳng hạn như axetonitril tạo ra 5-bromopyrazol tương ứng có công thức 6. Tương tự, có thể chuyển hoá 5-aminopyrazol có công thức 4a thành muối diazoni và sau đó thành 5-halopyrazol tương ứng có công thức 6 bằng cách xử lý bằng natri nitrit trong các dung môi chẳng hạn như nước, axit axetic hoặc axit trifloaxetic, với sự có mặt của axit vô cơ thường chứa cùng nguyên tử halogenua (chẳng hạn như dung dịch HI trong nước với G là I), sau đó xử lý bằng muối đồng(I) hoặc đồng(II) tương ứng theo quy trình chung mà các người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này đã biết. Phương pháp theo Sơ đồ 4 được thể hiện bằng bước B của ví dụ tổng hợp 1 và bước D của ví dụ tổng hợp 2.



Sơ đồ 4

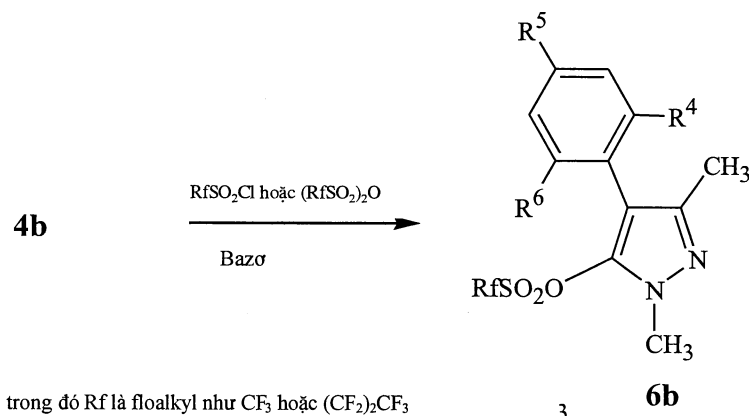
Như được thể hiện trên sơ đồ 5, có thể điều chế 5-bromopyrazol có công thức 6a (tức là Công thức 6 trong đó G là Br) bằng cách cho 5-hydroxypyrazol có công thức 4b (tức là Công thức 4 trong đó X là O) phản ứng với phospho tribromua như mô tả trong *Tetrahedron Lett.* 2000, 41(24), 4713.

Sơ đồ 5



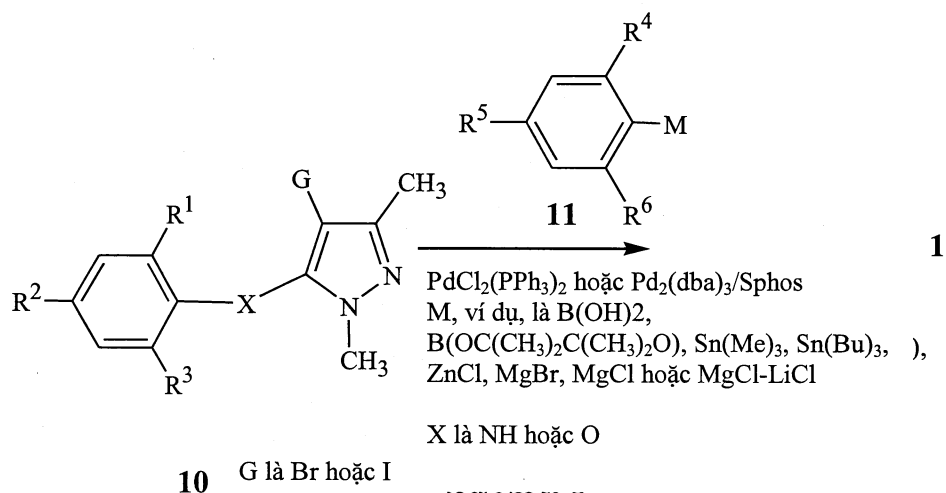
Như được thể hiện trên sơ đồ 6, cũng có thể sử dụng các 5-hydroxypyrazol có công thức 4b để điều chế 5-floalkylsulfonyl (ví dụ, 5-triflometansulfonyl, 5-nonaflobutylsulfonyl) pyrazol có công thức 6b (tức là Công thức 6 trong đó G là floalkylsulfonyl) như mô tả trong *Synlett* 2004, 5, 795.

Sơ đồ 6



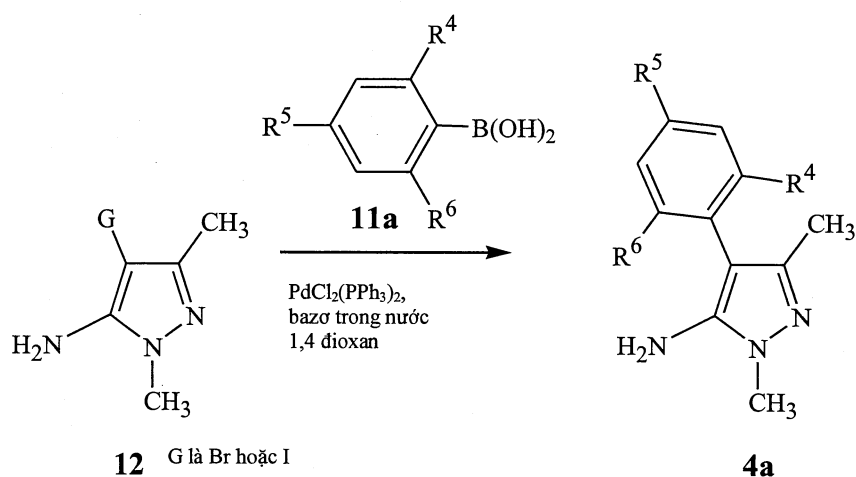
Như được thể hiện trên sơ đồ 7, có thể điều chế hợp chất có công thức 1 bằng cách cho 4-bromo hoặc iodo pyrazol có công thức 10 trong đó X là O hoặc NH phản ứng với các hợp chất hữu cơ kim loại có công thức 11 ở điều kiện phản ứng ngẫu hợp chéo được xúc tác bằng kim loại chuyển tiếp. Phản ứng của 4-bromo hoặc iodo pyrazol có công thức 10 với axit boronic, trialkyl-thiêc, kẽm hoặc chất phản ứng magie hữu cơ có công thức 11 với sự có mặt của chất xúc tác paladi hoặc niken có các phối tử thích hợp (ví dụ, triphenylphosphin (PPh₃), đibenzylidenaxeton (dba), đixyclohexyl(2',6'-đimetoxy[1,1'-biphenyl]-2-yl)phosphin (SPhos)) và bazơ, nếu cần, tạo ra hợp chất tương ứng có công thức 1. Ví dụ, axit boronic được thế aryl hoặc dẫn xuất ví dụ, Công thức 11 trong đó M là B(OH)₂, B(OC(CH₃)₂C(CH₃)₂O)) hoặc B(O-*i*-Pr)₃, Li, phản ứng với 4-bromo- hoặc 4-iodopyrazol có công thức 10 với sự có mặt của điclobis(triphenylphosphin) paladi(II) và bazơ trong nước chẳng hạn như natri cacbonat hoặc kali hydroxit, trong các dung môi chẳng hạn như 1,4-dioxan, 1,2-dimetoxyetan, toluen hoặc rượu etylic, hoặc trong điều kiện khan phản ứng với phối tử chẳng hạn như phosphin oxit hoặc phối tử phosphit (ví dụ, diphenylphosphin oxit) và kali florua trong dung môi chẳng hạn như 1,4-dioxan (xem *Angewandte Chemie, International Edition* 2008, 47(25), 4695–4698) để tạo ra hợp chất tương ứng có công thức 1. Phương pháp của Sơ đồ 7 được thể hiện bằng bước C của ví dụ tổng hợp 3 trong sáng chế này.

Sơ đồ 7



Như được minh họa trên Sơ đồ 8, có thể điều chế hợp chất có công thức 4a (tức là Công thức 4 trong đó X là NH) bằng cách cho hợp chất có công thức 12 phản ứng với hợp chất có công thức 11a (ví dụ, các hợp chất có công thức 11 trong đó M là $\text{B}(\text{OH})_2$) bằng cách sử dụng điều kiện phản ứng ngẫu hợp chéo được xúc tác bằng kim loại chuyển tiếp như mô tả cho phương pháp của Sơ đồ 7.

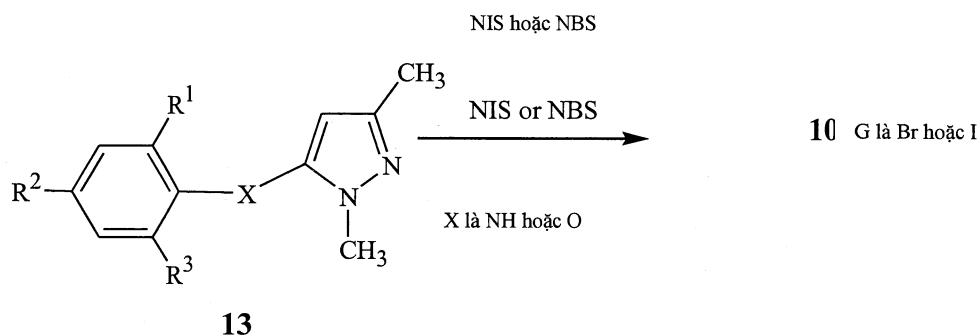
Sơ đồ 8



Như được minh họa trên Sơ đồ 9, có thể điều chế dễ dàng các pyrazol có công thức 10 trong đó X là O hoặc NH và G là Br hoặc I bằng cách cho các pyrazol không

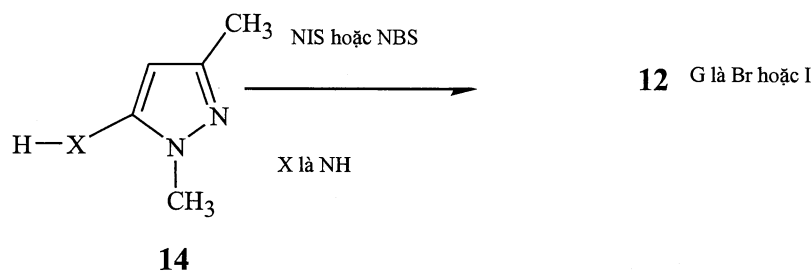
được thế ở vị trí 4 (Công thức 13) phản ứng với các chất phản ứng halogen hóa chẳng hạn như brom, natri bromit, *N*-bromosuxinimit (NBS) hoặc *N*-iodosuxinimit (NIS), trong dung môi chẳng hạn như axit axetic, axetonitril, *N,N*-đimetylformamit, *N,N*-đimetylaxetamit hoặc 1,4-đioxan, hoặc hỗn hợp của nước với dung môi nêu trên, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ môi trường đến điểm sôi của dung môi này. Phương pháp nêu ở Sơ đồ 9 được thể hiện bằng bước B của ví dụ tổng hợp 3.

Sơ đồ 9



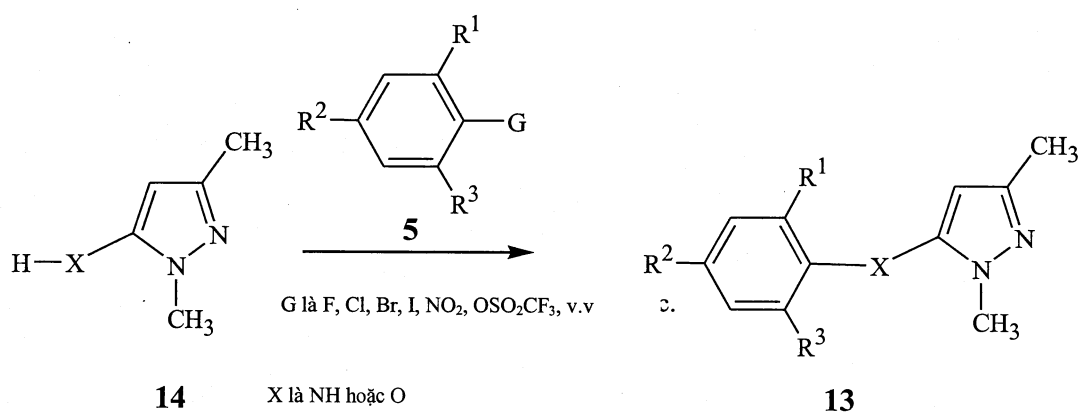
Như được minh họa trên Sơ đồ 10, bằng cách sử dụng các điều kiện phản ứng tương tự với các điều kiện cho phương pháp nêu ở Sơ đồ 9, có thể chuyển hoá pyrazol có công thức 14 trong đó X là NH thành các hợp chất trung gian 12 mà là hữu ích để điều chế các hợp chất có công thức 4a như được thể hiện trên Sơ đồ 8. Có thể điều chế hợp chất có công thức 14 trong đó X là NH theo các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Ngoài ra, hợp chất có công thức 14 trong đó X là NH là có sẵn trên thị trường.

Sơ đồ 10



Như được thể hiện trên sơ đồ 11, có thể điều chế hợp chất có công thức 13 trong đó X là O hoặc NH từ hợp chất có công thức 14 tương ứng theo quy trình tương tự với quy trình được sử dụng cho phương pháp của Sơ đồ 2. Phương pháp của Sơ đồ 11 được thể hiện bằng bước A của ví dụ tổng hợp 3. Các hợp chất có công thức 14 là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

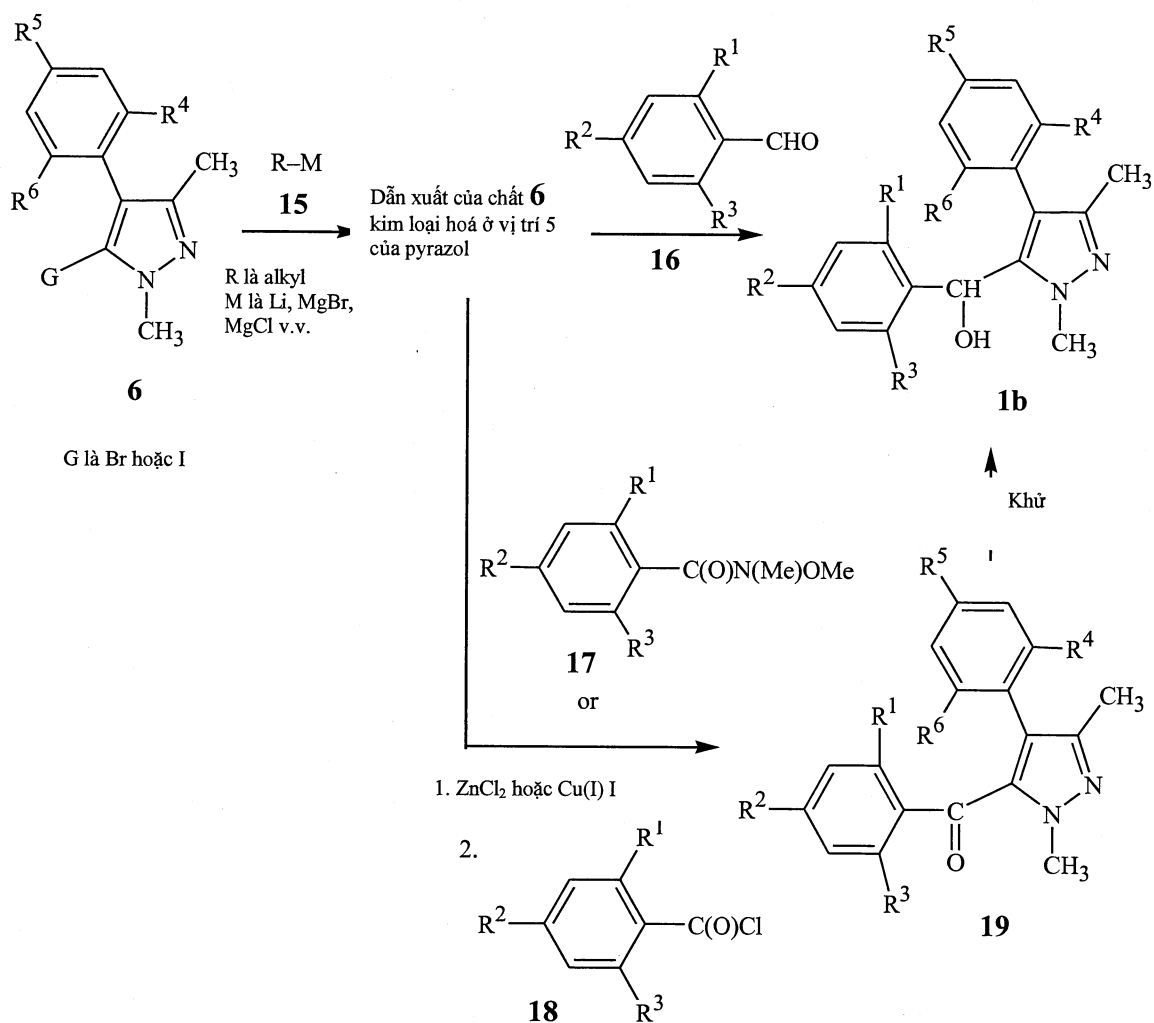
Sơ đồ 11



Như được thể hiện trên sơ đồ 12, có thể điều chế hợp chất có công thức 1b (tức là Công thức 1 trong đó X là CHOH), bằng cách xử lý hợp chất có công thức 6 bằng chất phản ứng kim loại hữu cơ (tức là Công thức 15) chẳng hạn như alkylolithi, tốt hơn nếu là chất phản ứng *n*-butyllithi, hoặc alkylmagie, tốt hơn nếu là isopropylmagie clorua (tuỳ ý được tạo phức hợp với lithi clorua), sau đó cộng với benzaldehyt được thể có công thức 16. Phương pháp theo Sơ đồ 12 này được thể hiện bằng ví dụ tổng hợp 5. Theo cách khác, có thể điều chế hợp chất có công thức 1b bằng cách khử các keton có công thức 19 bằng cách áp dụng các phương pháp tiêu chuẩn đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này (ví dụ, natri bohýđrua trong metanol hoặc metanol). Có thể điều chế các keton có công thức 19 bằng phản ứng của cùng dẫn xuất pyrazol được kim loại hóa của hợp chất có công thức 6 với chất có ái lực với điện tử cacbon có công thức 17 hoặc 18. Nhiệt độ phản ứng có thể thay đổi từ -90 °C đến điểm sôi của dung môi phản ứng; nhiệt độ từ -78 °C đến nhiệt độ môi trường thường là được ưu tiên, với nhiệt độ

từ -78 đến -10 °C được ưu tiên khi sử dụng chất phản ứng alkyllithi, và từ -20 °C đến nhiệt độ môi trường được ưu tiên khi sử dụng chất phản ứng alkylmagie. Có thể dùng nhiều loại dung môi, chẳng hạn như toluen, etyl ete, tetrahydrofuran hoặc dimetoxymetan; tetrahydrofuran khan là được ưu tiên. Tốt hơn nếu có thể bổ sung hợp phần kim loại phụ, chẳng hạn như kẽm clorua, kẽm bromua hoặc muối đồng hoá trị một, chẳng hạn như đồng(I) iotua hoặc đồng(I) xyanua, vào trước chất có ái lực với điện tử trong trường hợp trong đó chất có ái lực với điện tử là hợp chất có công thức 18. Các hợp chất trung gian carbonyl có công thức 16, 17 và 18 là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

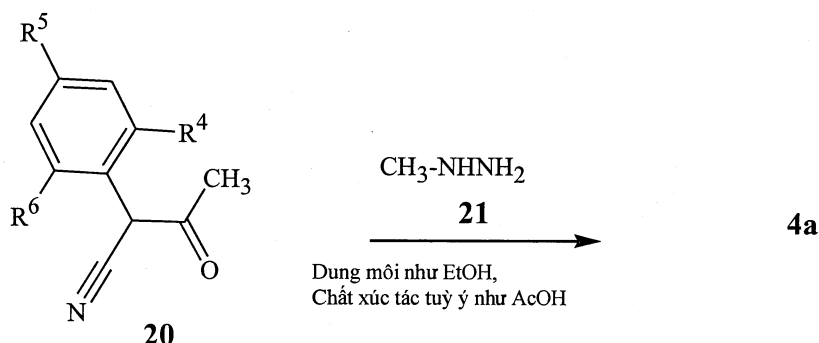
Sơ đồ 12



Điều sẽ được người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này nhận biết là ngoài ra các phản ứng tương tự với các phản ứng được thể hiện trong Sơ đồ 12 cũng có thể được dùng với pyrazol không có phần tử thế ở vị trí 4, do đó tạo ra một số hợp chất có công thức 13 là hữu ích trong phương pháp được nêu trong Sơ đồ 9.

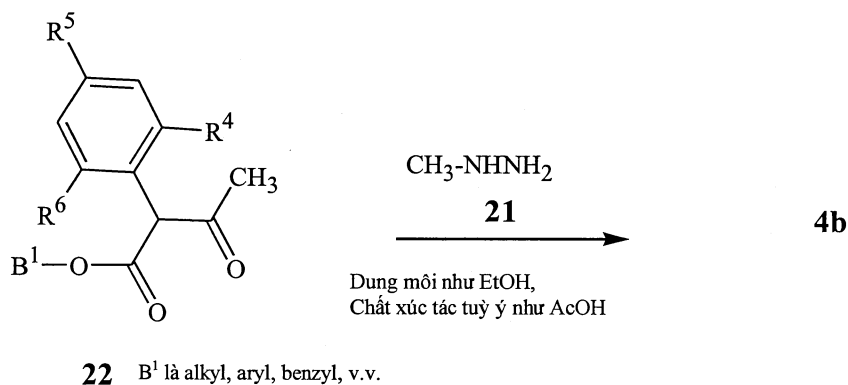
Các phương pháp chung hữu ích để điều chế 5-aminopyrazol có công thức 4a là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này; xem chẳng hạn, *Journal für Praktische Chemie (Leipzig)* 1911, 83, 171 và *J. Am. Chem. Soc.* 1954, 76, 501. Phương pháp như vậy được minh họa trong Sơ đồ 13. Phương pháp theo Sơ đồ 13 được thể hiện bằng bước A của ví dụ tổng hợp 1 và bước C của ví dụ tổng hợp 2 theo sáng chế.

Sơ đồ 13



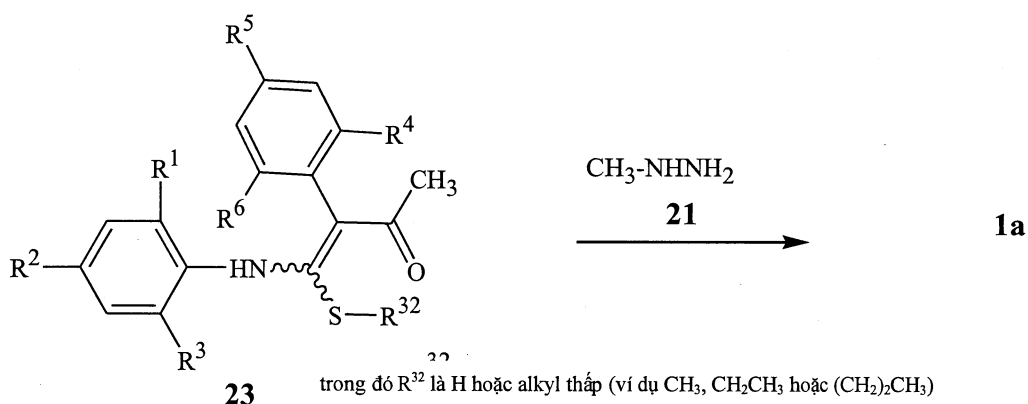
Tương tự, các phương pháp chung hữu ích để điều chế 5-hydroxypyrazol có công thức 4b đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này; xem chẳng hạn, *Annalen der Chemie* 1924, 436, 88. Phương pháp như vậy được minh họa trong Sơ đồ 14. Phương pháp theo Sơ đồ 14 được thể hiện bằng bước C của ví dụ tổng hợp 6 theo sáng chế.

Sơ đồ 14



Như được thể hiện trên sơ đồ 15, có thể điều chế hợp chất có công thức 1a (tức là Công thức 1 trong đó X là NH) bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức 23 với metylhydrazin (Công thức 21) trong dung môi chẳng hạn như etanol hoặc metanol và tùy ý với sự có mặt của chất xúc tác axit hoặc bazơ chẳng hạn như axit axetic, piperidin hoặc natri metoxit, theo quy trình chung đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Phương pháp theo Sơ đồ 15 được thể hiện bằng bước B của ví dụ tổng hợp 4, và bước C của ví dụ tổng hợp 7.

Sơ đồ 15

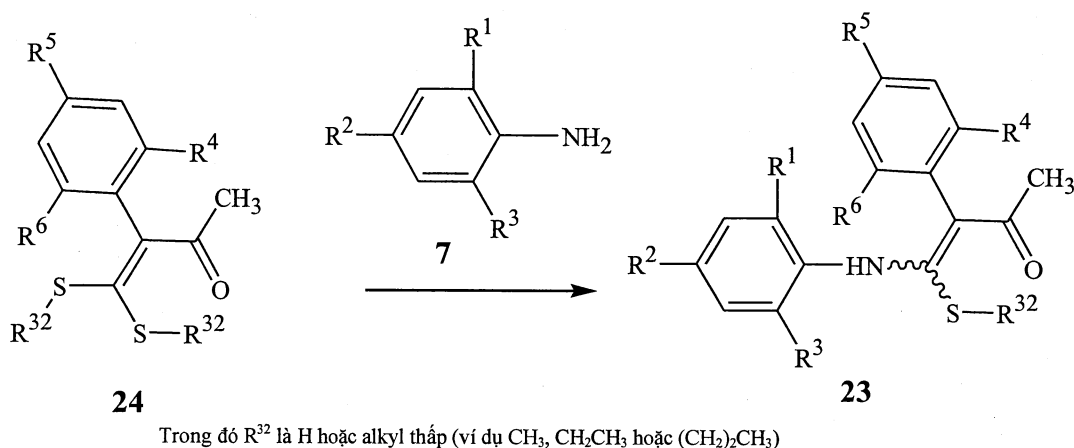


Theo cách tương tự với phương pháp nêu ở Sơ đồ 15, các hợp chất có công thức 2 trong đó X là NH có thể được điều chế theo cách tương tự bằng cách ngưng tụ

hợp chất có công thức 23 với hydrazin. Phương pháp này được mô tả trong *Chemistry of Heterocyclic Compounds* 2005, 41(1), 105–110.

Như được thể hiện trên sơ đồ 16, có thể điều chế hợp chất có công thức 23 (trong đó, R^{32} là H hoặc alkyl thấp chẳng hạn như CH_3 , CH_2CH_3 hoặc $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$) bằng cách cho hợp chất keten dithioaxetal tương ứng có công thức 24 phản ứng với hợp chất có công thức 7 tùy ý với sự có mặt của bazơ, chẳng hạn như natri hydrua hoặc etylmagie clorua, trong dung môi chẳng hạn như toluen, tetrahydrofuran hoặc dimetoxymetan, ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ $-10\text{ }^\circ\text{C}$ đến điểm sôi của dung môi này. Xem chẳng hạn, *J. Heterocycl. Chem.* 1975, 12(1), 139. Các phương pháp hữu ích để điều chế hợp chất có công thức 24 là đã được biết đến trong lĩnh vực kỹ thuật này.

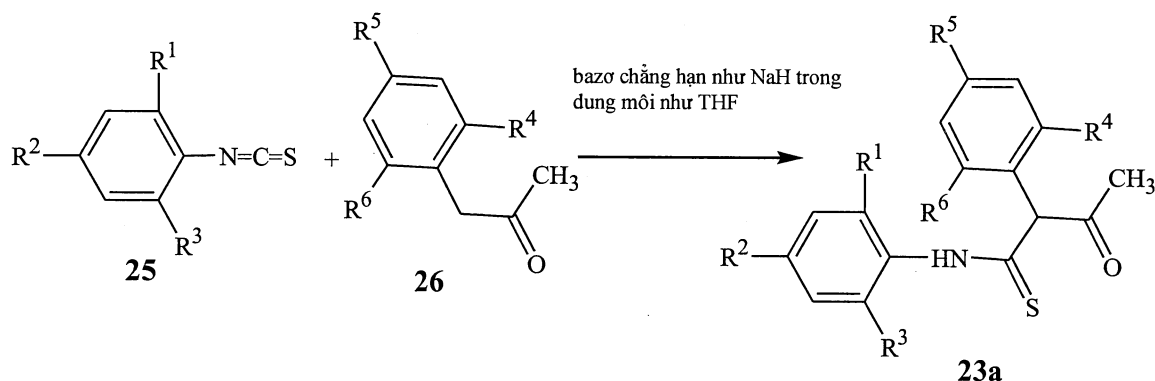
Sơ đồ 16



Như được thể hiện trên sơ đồ 17, có thể điều chế hợp chất có công thức 23a (tức là tautome có công thức 23 trong đó R^{32} là H) bằng cách cho các hợp chất isothioxyanat tương ứng có công thức 25 phản ứng với hợp chất arylaxeton có công thức 26; xem chẳng hạn, *Zhurnal Organicheskoi Khimii* 1982, 18(12), 2501. Các bazơ hữu ích cho phản ứng này bao gồm các bazơ natri hydrua, alkoxit (ví dụ, kali *tert*-butoxit hoặc natri etoxit), kali hydroxit, natri hydroxit, kali cacbonat, hoặc các bazơ amin (ví dụ, trietylamin hoặc *N,N*-điisopropyletylamin). Có thể dùng nhiều dung môi, chẳng hạn như tetrahydrofuran, ete, toluen, *N,N*-dimetylformamit, rượu (ví dụ, etanol),

este (ví dụ, etyl axetat hoặc isopropyl axetat), hoặc các hỗn hợp của chúng. Dung môi được lựa chọn để tương thích với bazơ được chọn, như đã biết rõ trong lĩnh vực kỹ thuật này. Nhiệt độ phản ứng có thể thay đổi từ $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ đến điểm sôi của dung môi này. Một hỗn hợp hữu ích của bazơ và dung môi là kali *tert*-butoxit trong tetrahydrofuran, được cho thêm vào đó ở nhiệt độ -70 đến $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ là dung dịch chứa isothioxyanat có công thức 25 và hợp chất carbonyl có công thức 26, các chất này hoặc là được kết hợp vào một dung dịch, hoặc được cho vào riêng rẽ, tốt hơn nếu là bổ sung hợp chất carbonyl sau đó bổ sung isothioxyanat. Phương pháp theo Sơ đồ 17 được thể hiện ở bước A của ví dụ tổng hợp 4, và bước C của ví dụ tổng hợp 7.

Sơ đồ 17



Cũng có thể điều chế các ketothioamid có công thức 23a bằng cách cho các ketoamid tương ứng phản ứng với tác nhân sulfo hóa chẳng hạn như chất phản ứng Lawesson hoặc P_2S_5 ; xem chẳng hạn, *Helv. Chim. Act.* 1998, 81(7), 1207.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này nhận biết rằng các nhóm chức khác nhau có thể được chuyển hoá thành các nhóm khác để tạo ra hợp chất có công thức 1 khác nhau. Ví dụ như, các hợp chất trung gian để điều chế các hợp chất có công thức 1 có thể chứa các nhóm nitro thơm, các nhóm này có thể được khử thành các nhóm amino, và sau đó thông qua các phản ứng đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này chẳng hạn như phản ứng Sandmeyer được chuyển hoá thành các halogenua khác nhau, tạo ra các hợp chất có công thức 1 khác. Thông qua các phản ứng tương tự

đã biết, các amin thơm (anilin) có thể được chuyển hoá thông qua các muối diazoni thành phenol, sau đó các chất này có thể được alkyl hoá để tạo ra các hợp chất có công thức 1 với các phần tử thay thế alkoxy. Tương tự, các halogenua thơm chẳng hạn như bromua hoặc ioda được điều chế thông qua phản ứng Sandmeyer có thể phản ứng với rượu trong điều kiện có xúc tác đồng, chẳng hạn như phản ứng Ullmann hoặc các cải biến đã biết khác của chúng, để tạo ra các hợp chất có công thức 1 chứa các phần tử thay thế alkoxy. Ngoài ra, một số nhóm halogen, chẳng hạn như flo hoặc clo, có thể được thay thế bằng rượu ở điều kiện kiềm để tạo ra các hợp chất có công thức 1 chứa các phần tử thay thế alkoxy tương ứng.

Trong nhiều trường hợp các phản ứng nêu trên cũng có thể được thực hiện theo trình tự xen kẽ, chẳng hạn như việc điều chế 1*H* pyrazol để sử dụng trong phản ứng trong Sơ đồ 2 bằng các phản ứng được minh họa sau đó để điều chế chung các pyrazol được thể.

Nhận biết được rằng một số chất phản ứng và các điều kiện phản ứng đã nêu trên để điều chế các hợp chất có công thức 1 có thể không tương thích với các nhóm chức nhất định có mặt trong các chất trung gian. Trong các trường hợp này, việc kết hợp các trình tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc sự chuyển hoá giữa các nhóm chức trong quá trình tổng hợp sẽ trợ giúp cho việc thu nhận sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ sẽ là rõ ràng đối với chuyên gia trong lĩnh vực tổng hợp hoá học (xem chẳng hạn, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ nhận biết được rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng nêu ra như được thể hiện trong sơ đồ riêng rẽ bất kỳ, có thể cần thiết thực hiện thêm các bước tổng hợp thông thường không được mô tả chi tiết để hoàn toàn quá trình tổng hợp hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ nhận biết rằng có thể cần thiết thực hiện kết hợp các bước được minh họa trong các sơ đồ nêu trên theo một trật tự khác với trình tự cụ thể được trình bày để điều chế hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trung bình

trong lĩnh vực kỹ thuật này cũng sẽ nhận biết rằng các hợp chất có công thức 1 và các chất trung gian được mô tả trong bản mô tả này có thể được xử lý khác nhau bằng các phản ứng ưa điện tử, ưa nhân, gốc, hữu cơ kim loại, oxy hoá, và khử để thêm các phân tử thay thế hoặc biến đổi các phân tử thay thế hiện có.

Không cần mô tả chi tiết thêm nữa, cho rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này khi tham khảo phần mô tả trên đây có thể sử dụng sáng chế ở mức độ đầy đủ nhất. Do đó, các ví dụ tổng hợp sau đây được coi là chỉ có tính chất minh họa, và không giới hạn sáng chế theo bất kỳ cách nào. Các bước trong các ví dụ tổng hợp sau đây minh họa quy trình cho mỗi bước trong quá trình tổng hợp tổng thể, và nguyên liệu cho mỗi bước có thể không nhất thiết được điều chế theo một trình tự điều chế nhất định theo quy trình được mô tả trong ví dụ hoặc bước khác. Các giá trị phần trăm là tính theo trọng lượng chỉ trừ các hỗn hợp dung môi dùng trong sắc ký hoặc khi được quy định khác đi. Các giá trị phần và phần trăm cho các hỗn hợp dung môi dùng trong sắc ký là tính theo thể tích trừ khi được quy định khác đi. Phổ ^1H NMR được ghi lại theo ppm ở khu vực hoạt động từ tetrametylsilan trong CDCl_3 trừ khi được quy định khác đi; “s” dùng để chỉ vạch đơn, “m” dùng để chỉ vạch bội, “br s” dùng để chỉ vạch đơn rộng. Phổ khối (MS) được ghi lại theo trọng lượng phân tử của ion gốc dư đồng vị cao nhất ($\text{M}+1$) được tạo ra bằng cách bổ sung H^+ (trọng lượng phân tử 1) vào phân tử này, được quan sát bằng phép đo phổ khối bằng cách sử dụng ion hoá hóa học ở áp suất khí quyển (AP^+) trong đó “amu” dùng để chỉ đơn vị khối lượng nguyên tử. Sự có mặt của ion phân tử chứa một hoặc nhiều nguyên tố đồng vị trọng lượng nguyên tử cao hơn ở mức độ dư thấp hơn (ví dụ, ^{37}Cl , ^{81}Br) là không được báo cáo. “LC/MS” dùng để chỉ kết hợp của phương pháp tách vật lý các hợp chất hóa học bằng phương pháp sắc ký lỏng và phân tích khối lượng của các hợp chất được tách riêng bằng phổ khối.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ tổng hợp 1

Điều chế 4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-điflo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 3)

Bước A: Điều chế 4-[2-clo-4-flophenyl]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin

Khuấy huyền phù của natri etoxit rắn khô (Aldrich, 10,2 g, 150 mmol) trong hỗn hợp gồm xylen (60 ml) và etanol khan (25 ml) ở nhiệt độ 70 °C, và cho vào từng giọt dung dịch chứa 2-clo-4-flobenzenaxetonitril (16,96 g, 100 mmol) trong hỗn hợp gồm etyl axetat (30 ml) và etanol (5 ml) vào hỗn hợp phản ứng nóng này trong thời gian 20 phút. Hỗn hợp phản ứng này được gia nhiệt ở nhiệt độ 75–78 °C trong thời gian 3 h và sau đó được để nguội. Cho nước (50 ml) vào để hòa tan chất rắn. Hỗn hợp này được chiết một lần bằng etyl axetat, và dịch chiết được bỏ đi. Pha nước được axit hoá đến pH 2 bằng cách bổ sung axit clohydric 1 N trong nước, và sau đó chiết bằng etyl axetat (50 ml). Làm khô (MgSO₄) pha etyl axetat và làm bay hơi để tạo ra sản phẩm trung gian α -axetyl-2-clo-4-flobenzenaxetonitril dưới dạng chất rắn (14,8 g).

Khuấy một phần sản phẩm thu được nêu trên (4,61 g, 21,8 mmol) trong etanol (15 ml), và cho axit axetic băng (3 ml) và metylhydrazin (1,17 ml, 21,8 mol) vào. Khuấy hỗn hợp phản ứng này và gia nhiệt qua đêm ở điều kiện hồi lưu. Sau đó cô đặc hỗn hợp phản ứng này dưới áp suất giảm, và nghiền phần còn lại thu được bằng etyl axetat. Gom chất rắn thu được trên hỗn hợp nấu thủy tinh và làm khô trong không khí để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng (2,42 g).

¹H NMR δ 7,2–7,3 (m, 2H), 7,0 (m, 1H), 3,7 (s, 3H), 3,4 (br s, 2H), 2,1 (s, 3H). MS: 240 amu (AP⁺).

Bước B: Điều chế 5-bromo-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol

Cho đồng(II) bromua (3,94 g, 17,7 mmol) vào dung dịch chứa 4-[2-clo-4-flophenyl]-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (tức là sản phẩm của bước A) (2,4 g, 10

mmol) trong axetonitril (50 ml), và khuấy hỗn hợp này và làm lạnh trong bể nước đá đồng thời cho từng giọt *tert*-butyl nitrit (tinh khiết kỹ thuật 90%, 2,33 ml, 17,7 mmol) vào trong thời gian 5 phút. Làm ấm từ từ hỗn hợp phản ứng này đến nhiệt độ môi trường. Cho dung dịch nước HCl dung dịch (20 ml) vào, và sau đó cho etyl axetat vào (20 ml). Hỗn hợp này được lọc qua tấm 2cm chất trợ lọc đất tảo Celit[®]. Tấm lọc này được rửa bằng etyl axetat (20 ml), và các pha được tách riêng. Rửa pha hữu cơ bằng 1,0 N dung dịch axit clohydric trong nước và nước muối, làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc để lại hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất bán rắn màu nâu cam (2,8 g).

¹H NMR δ 7,18–7,25 (m, 2H), 7,04 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,14 (s, 3H).

Bước C: Điều chế 4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2,6-điflo-4-metoxyphephenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin

Trộn 5-bromo-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol (tức là sản phẩm của bước B) (0,20 g, 0,66 mmol), paladi(II) axetat (15 mg, 0,066 mmol), 4,5-bis(điphenylphosphino)-9,9-đimetylanten (76 mg, 0,13 mmol) và kali cacbonat dạng bột (1,8 g, 13 mmol) trong 1,4-đioxan khan (3 ml), và sục hỗn hợp này bằng dòng khí N₂ dưới bề mặt N₂ trong thời gian 10 phút. Cho 2,6-điflo-4-metoxyanilin (0,22 g, 1,3 mmol) vào làm một lần, và gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này ở nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 22 h. Lọc hỗn hợp phản ứng này qua chất trợ lọc đất tảo Celit[®], và rửa tấm lọc này bằng etyl axetat (20 ml). Dịch lọc được rửa bằng nước (10 ml) và nước muối (10 ml), làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc để lại phần còn lại là chất bán rắn. Phần còn lại này được tinh chế bằng sắc ký cột qua 5 g silicagel đã được rửa giải bằng gradient hexan/etyl axetat (20:1 đến 1:3) để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu nâu nhạt (48 mg).

¹H NMR δ 7,0–7,1 (m, 2H), 6,85 (m, 1H), 6,26 (m, 2H), 4,84 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,66 (s, 3H), 2,08 (s, 3H). MS: 382 amu (AP⁺).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế 4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 7)

Bước A: Điều chế 2,6-điflo-4-metoxibenzenaxetonitril

Cho từng giọt dung dịch KCN (0,88 g, 13 mmol) đã được hoà tan trong nước (2 ml) vào dung dịch được làm lạnh trong bể nước chứa 2,6-điflo-4-metoxibenzyl bromua (2,50 g, 10,5 mmol) trong *N,N*-đimetylformamit (10 ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng này trong thời gian 20 phút. Cho nước vào (20 ml) và sau đó rót hỗn hợp phản ứng này vào dung dịch NaHCO₃ bão hoà trong nước (20 ml) và chiết bằng ete (50 ml). Pha hữu cơ được rửa bằng nước (5 x 25 ml), làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc để tạo ra chất dầu, chất này được kết tinh khi để yên để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng (1,9 g).

¹H NMR δ 6,50 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,65 (s, 2H).

Bước B: Điều chế α-axetyl-2,6-điflo-4-metoxibenzenaxetonitril

Khuấy natri etoxit rắn (4,7 g, 66 mmol) trong hỗn hợp gồm xylen (20 ml) và etanol (10 ml) và gia nhiệt đến nhiệt độ 50°C. Cho từng giọt dung dịch chứa 2,6-điflo-4-metoxibenzenaxetonitril (tức là sản phẩm của Bước A) (8,0 g, 44 mmol) trong etyl axetat (10,4 ml) vào. Gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này ở nhiệt độ 50°C trong thời gian 4 h và sau đó làm nguội xuống nhiệt độ môi trường. Hỗn hợp phản ứng này được rót vào nước (100 ml) và chiết bằng etyl axetat (25 ml). Pha nước được axit hoá 3 N dung dịch nước HCl to pH 4 và được chiết bằng etyl axetat (100 ml). Rửa pha hữu cơ này bằng nước (50 ml), nước muối (50 ml), sau đó làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc để lại hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất bán rắn màu nâu vàng (8,0 g).

¹H NMR δ 6,56 (m, 2H), 4,86 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,40 (s, 3H).

Bước C: điều chế 4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin

Khuấy α -axetyl-2,6-điflo-4-metoxypheylaxetonitril (tức là sản phẩm của Bước B) (8,03 g, 35,7 mmol) và axit axetic (5 ml) trong etanol (35 ml), và cho metylhydrazin (1,91 ml, 35,7 mmol) vào. Gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này ở nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 16 h, làm lạnh, và sau đó rót vào nước (100 ml). Chiết hỗn hợp thu được này bằng etyl axetat (100 ml). Rửa pha hữu cơ bằng dung dịch NaOH trong nước 1 N (50 ml) và sau đó là nước muối (50 ml), làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để lại chất rắn. Hoà tan chất rắn trong metanol, và làm ẩm dung dịch thu được tới nhiệt độ 45°C. Cho từng giọt nước (25 ml) vào, và hỗn hợp này được để nguội. Thu gom chất kết tủa trên hỗn hợp nấu thủy tinh để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng (3,88 g).

^1H NMR δ 6,55 (m, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,67 (s, 3H), 3,43 (br s, 2H), 2,09 (s, 3H).

Bước D: điều chế 5-bromo-4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol

Cho đồng(II) bromua (3,81 g, 16,9 mmol) vào dung dịch chứa 4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (tức là sản phẩm của Bước C) (3,88 g, 15,4 mmol) trong axetonitril (50 ml), và khuấy hỗn hợp này và làm lạnh trong bể nước đá đồng thời cho từng giọt *tert*-butyl nitrit (90% tinh khiết cấp độ kỹ thuật, 3,54 ml, 26,9 mmol) vào trong thời gian 5 phút. Để ấm từ từ hỗn hợp phản ứng này xuống nhiệt độ môi trường. Cho dung dịch axit clohydric trong nước (25 ml) vào, sau đó cho etyl axetat (25 ml) vào, và lọc hỗn hợp thu được này qua tấm dày 2cm chất trợ lọc đất tảo Celite®. Rửa tấm lọc này bằng etyl axetat (50 ml), và các pha được tách riêng. Pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước HCl 1 N (25 ml) và nước muối (25 ml), làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột qua 24 g silicagel với rửa giải bằng gradient hexan/etyl axetat (9:1 đến 1:1) để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng (3,25 g).

^1H NMR δ 6,54 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,83 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Bước E: điều chế 4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-*N*-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amin

Trộn 5-bromo-4-(2,6-điflo-4-metoxypheyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol (tức là sản phẩm của Bước D) (0,30 g, 0,94 mmol), paladi(II) axetat (20 mg, 0,090 mmol), 4,5-bis(điphenylphosphino)-9,9-đimetylanten (0,11 g, 0,19 mmol) và kali cacbonat dạng bột (2,6 g, 19 mmol) trong 1,4-đioxan khan (4 ml), và sục hỗn hợp thu được này bằng dòng khí N_2 dưới bề mặt trong thời gian 10 phút. Thêm 2,4,6-trifloanilin (0,28 g, 1,9 mmol) vào làm một lần, và gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này ở nhiệt độ hồi lưu dưới khí quyển nitơ trong thời gian 22 h. Làm nguội hỗn hợp phản ứng này, sau đó lọc qua chất trợ lọc đất tảo Celite[®]. Rửa tấm lọc này bằng etyl axetat (20 ml), và dịch lọc được rửa bằng nước (10 ml) và nước muối (10 ml), làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để lại phần còn lại bán rắn. Tinh chế phần còn lại bằng sắc ký cột qua 12 g silicagel với rửa giải bằng gradient hexan/etyl axetat (20:1 đến 1:3) để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất bán rắn (73 mg).

^1H NMR (axeton- d_6) δ 6,84 (br s, 1H), 6,68 (m, 2H), 6,43 (m, 2H), 3,77 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 1,99 (s, 3H). MS: 384 amu (AP^+).

Ví dụ tổng hợp 3

Điều chế 4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 13)

Bước A: Điều chế 4-[(1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]-3,5-điflobenzonitril

Cho kali cacbonat (1,38 g, 10 mmol) vào dung dịch chứa 2,4-đihydro-2,5-đimetyl-3*H*-pyrazol-3-on (0,70 g, 6,3 mmol) trong *N,N*-đimetylformamit (15 ml). Cho 3,4,5-triflobenzonitril (0,94 g, 6,0 mmol) vào, và gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này

ở nhiệt độ 75°C trong khí quyển nitơ trong thời gian 16 h, sau đó để nguội. Hỗn hợp phản ứng này được phân bố giữa nước (60 ml) và etyl axetat (30 ml). Pha hữu cơ này được rửa bằng nước (2 x 30 ml) và nước muối (30 ml), làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng dầu thô màu vàng (1,38 g).

¹H NMR δ 7,36 (m, 2H), 5,24 (s, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Bước B: Điều chế 3,5-điflo-4-[(4-iodo-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]benzonitril

Khuấy dung dịch chứa 4-[(1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]-3,5-điflobenzonitril (tức là sản phẩm của Bước A) (1,38 g, 5,5 mmol) trong axetonitril (20 ml) ở nhiệt độ môi trường, và thêm *N*-iodosuxinimit (1,35 g, 6,0 mmol) vào làm một lần. Gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này ở nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 2 h, làm lạnh, và sau đó rót vào nước (40 ml). Chiết hỗn hợp thu được này bằng etyl axetat (40 ml). Rửa pha hữu cơ bằng nước (20 ml) và dung dịch NaHCO₃ trong nước bão hoà (20 ml), làm khô bằng MgSO₄, và cô đặc dưới áp suất giảm để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu nâu vàng (2,1 g).

¹H NMR (axeton-d₆) δ 7,80 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 2,09 (s, 3H). MS: 376 amu (AP⁺).

Bước C: Điều chế 4-[[4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril

Cho axit 2-clo-4-flobenzenboronic (theo cách khác được gọi là axit *B*-(2-clo-4-flophenyl)boronic) (0,93 g, 5,33 mmol), điclo (bis)triphenylphosphin paladi(II) (theo cách khác được gọi là bis(triphenylphosphin)paladi(II) điclorua) (93 mg, 0,13 mmol), kali cacbonat (0,74 g, 5,33 mmol), và nước (4 ml) vào dung dịch chứa 3,5-điflo-4-[(4-iodo-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]benzonitril (tức là sản phẩm của Bước B) (1,0 g, 2,67 mmol) trong 1,4-đioxan (6 ml). Gia nhiệt hỗn hợp thu được này ở nhiệt độ hồi

lưu trong thời gian 5 h, để nguội, và phân chia giữa nước (20 ml) và etyl axetat (20 ml). Làm khô lớp hữu cơ trên MgSO_4 và cô đặc. Tinh chế phần còn lại bằng phương pháp sắc ký trên silicagel với gradient của hexan / etyl axetat để thu được hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (110 mg).

^1H NMR δ 7,00–7,09 (m, 3H), 6,97 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 2,02 (s, 3H).

Ví dụ tổng hợp 4

Điều chế 4-(2,4-điclophenyl)-*N*-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 17)

Bước A: Điều chế α -axetyl-2,4-điclo-*N*-(2,4-điflophenyl)benzenthioamit

Cho 2,4-điflophenyl isothioxyanat (0,27 ml, 2,0 mmol) vào huyền phù được khuấy của natri hydrua (60% trong dầu khoáng) (112 mg, 2,8 mmol) trong tetrahydrofuran khan (4 ml) được làm lạnh trong bể nước đá dưới khí nitơ. Cho từng giọt dung dịch chứa 1-(2,4-điclophenyl)-2-propanon (570 mg, 2,8 mmol) trong tetrahydrofuran (4 ml) vào trong thời gian 5 phút. Khuấy dung dịch thu được màu vàng ở nhiệt độ 5–10 °C trong thời gian 1 h. Cho cẩn thận nước (10 ml) vào, và chiết hỗn hợp phản ứng này bằng etyl axetat (10 ml). Pha nước được axit hoá đến độ pH 3 bằng dung dịch nước HCl 1 N, sau đó được chiết bằng etyl axetat (20 ml). Dịch chiết hữu cơ này được rửa bằng nước (10 ml) và nước muối (10 ml), làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để lại chất rắn. Nghiền chất rắn với hexan / etyl axetat (2:1), được gom trên hỗn hợp nẫu thủy tinh, và làm khô trong không khí để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng (240 mg). MS: 373 amu (AP^+).

Bước B: Điều chế 4-(2,4-điclophenyl)-*N*-(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin

Cho axit axetic (50 μ l) và metylhydrazin (41 μ l) vào huyền phù có khuấy của α -axetyl-2,4-điclo-*N*-(2,4-điflophenyl)benzenthioamit (238 mg, 0,64 mmol) trong etanol (4 ml). Gia nhiệt ở nhiệt độ hồi lưu hỗn hợp phản ứng này trong thời gian 2 h và để nguội. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được pha loãng với etyl axetat (10 ml) và rửa bằng NaOH 1 N trong nước (10 ml), nước (10 ml) và nước muối (10 ml), làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để lại phần còn lại là chất rắn. Tinh chế phần còn lại bằng sắc ký cột trên 5 g silicagel với gradient hexan/etyl axetat (2:1 đến 1:1) để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn (170 mg).

^1H NMR δ 7,43 (s, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 6,62 (m, 1H), 6,37 (m, 1H), 5,22 (br s, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,18 (s, 3H). MS: 368 amu (AP^+).

Ví dụ tổng hợp 5

Điều chế 4-(2-clo-4-flophenyl)- α -(2,4-điflophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-metanol (Hợp chất 122)

Hoà tan 5-bromo-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol (tức là sản phẩm của ví dụ tổng hợp 1, bước B) (0,25 g, 0,82 mmol) trong tetrahydrofuran khan (12 ml), và làm nguội hỗn hợp này trong bể đá khô/axeton dưới khí nitơ. Cho từng giọt dung dịch *n*-butyllithi (2,0 M, 0,49 ml, 0,98 mmol) trong hexan vào trong thời gian 5 phút. Sau 15 phút, cho từ từ từng giọt dung dịch chứa 2,4-điflobenzaldehyt (0,09 ml, 0,82 mmol) trong tetrahydrofuran khan (3 ml) vào, làm cho dung dịch có màu đỏ sẫm sáng lên thành màu vàng. Sau 45 phút, dập tắt hỗn hợp phản ứng này bằng cách thêm dung dịch NH_4Cl bão hoà trong nước (~20 ml) và làm ấm đến nhiệt độ môi trường. Chiết hỗn hợp bằng etyl axetat, và rửa pha hữu cơ bằng dung dịch NH_4Cl trong nước bão hoà (25 ml) và bằng nước muối, làm khô bằng Na_2SO_4 , và cô đặc để

lại phần còn lại nhót. Tinh chế phần còn lại này bằng sắc ký cột bằng cách rửa giải bằng silicagel bằng gradient etyl axetat trong hexan (7% đến 10%) để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất bán rắn màu trắng (109 mg).

^1H NMR δ 7,5 (m, 1H), 7,1 (m, 2H), 7,0 (m, 1H), 6,85 (m, 2H), 6,0 (br s, 1H), 5,9 (s, 1H), 3,8 (s, 3H), 2,1 (s, 3H). MS: 367 amu (AP^+).

Ví dụ tổng hợp 6

Điều chế 4-[[1,3-đimetyl-4-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril (Hợp chất 8)

Bước A: điều chế metyl 2,4,6-triflobenzenaxetat

Khuấy dung dịch chứa axit 2,4,6-triflobenzenaxetic (5,00 g, 26,3 mmol) trong metanol (25 ml) ở nhiệt độ môi trường, và cho từng giọt thionyl clorua (6 ml, ~ 3 đương lượng) vào, làm cho nhiệt độ của hỗn hợp phản ứng này đạt đến 60°C. Làm nguội hỗn hợp phản ứng này xuống nhiệt độ môi trường và khuấy trong thời gian 3 h. Cho nước (25 ml) vào đồng thời làm mát bằng nước đá. Chiết hỗn hợp này bằng etyl axetat (2 x 100 ml). Pha hữu cơ hỗn hợp được rửa lần lượt bằng nước (2x), dung dịch natri bicacbonat trong nước bão hoà và nước muối, và làm khô bằng MgSO_4 . Cô đặc hợp chất tạo ra nêu ở đề mục dưới dạng dầu trong (5,38 g).

^1H NMR δ 6,68 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 3,66 (s, 2H).

Bước B: điều chế metyl α -axetyl-2,4,6-triflobenzenaxetat

Cho từng giọt dung dịch metyl 2,4,6-triflobenzenaxetat (tức là sản phẩm của Bước A) (2,04 g, 10,0 mmol) đã được hoà tan trong tetrahydrofuran khô (10 ml) trong thời gian 30 phút vào dung dịch lithi bis(trimetylsilyl)amit (1,0 M, 21,0 ml) trong tetrahydrofuran mua được đã được khuấy trong khí quyển nitơ và được làm lạnh xuống nhiệt độ bên trong -65°C. Khuấy hỗn hợp phản ứng này trong 30 phút nữa, và

sau đó đồng thời duy trì nhiệt độ -65°C , cho từng giọt dung dịch chứa axetyl clorua vừa mới được cất (0,80 ml, 11 mmol) trong tetrahydrofuran khô (3 ml) vào. Để ấm từ từ hỗn hợp phản ứng này xuống nhiệt độ môi trường, và sau đó cho nước (30 ml) vào. Chiết hỗn hợp thu được bằng etyl axetat (60 ml). Pha nước được axit hoá bằng axit clohydric 1 N và chiết bằng etyl axetat (60 ml). Chỉ có dịch chiết trong etyl axetat đầu tiên được giữ lại, vì phân tích sắc ký lớp mỏng cho thấy là dịch chiết thứ hai chứa rõ ràng các tạp chất có cực ngoài sản phẩm mong muốn bổ sung. Dịch chiết trong etyl axetat đầu tiên được rửa tiếp lần lượt bằng axit clohydric 1 N, nước và nước muối, làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng dầu trong (1,86 g).

^1H NMR δ 6,69 (m, 2H), 3,7 (m, 1H và s, 3H), 1,87 (s, 3 H); sự cộng hưởng nhỏ ở 13,2 ppm và 4,9 ppm biểu thị sự có mặt của dạng hồ biến enol.

Bước C: điều chế 1,3-dimetyl-4-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-ol

Cho metylhydrazin (0,665 ml, 12,5 mmol) vào dung dịch chứa metyl α -axetyl-2,4,6-triflobenzenaxetat (tức là sản phẩm của Bước B) (2,46 g, 10,0 mmol) trong metanol (15 ml), và khuấy hỗn hợp này ở nhiệt độ môi trường trong thời gian 3 ngày. Cho dung dịch axit xitric trong nước (1 M, 10 ml) vào, và sau đó cho nước (50 ml) vào. Chiết hỗn hợp này bằng etyl axetat (2 x 50 ml). Dịch chiết trong etyl axetat hỗn hợp được rửa lần lượt bằng nước và nước muối, làm khô bằng MgSO_4 , và cô đặc để lại chất rắn màu vàng. Tạo huyền phù chất rắn này trong thể tích nhỏ etyl axetat (5 ml), từ từ cho thể tích tương đương hexan vào, và khuấy huyền phù này trong thời gian 30 phút. Thành phần chất rắn này được thu gom trên hỗn hợp nấu thủy tinh, rửa bằng phần nhỏ etyl axetat/ hexan (1:1 và 1:2 thể tích), và để khô trong không khí để tạo ra chất rắn màu trắng (1,02 g). Làm bay hơi of nước cái và xử lý phần còn lại thu được bằng thể tích nhỏ etyl axetat và hexan đã được mô tả tạo ra thêm 0,13 g chất rắn chứa hợp chất nêu ở đề mục (tổng số 1,15 g). Phân tích chất rắn kết hợp bằng LC/MS cho thấy là thành phần chủ yếu có khối lượng 242 (AP^+ và do vậy là chất đồng phân tách

thể vùng của hợp chất nêu ở đề mục) và một lượng nhỏ thành phần, khi rửa giải sau đó bằng sắc ký lỏng đảo pha cũng có khối lượng 242 (AP+). Tỷ lệ rõ ràng của thành phần này là 94:6.

^1H NMR (axeton- d_6) δ 6,95 (m, 2H), 3,52 (s, 3H), 1,98 (s, 3H); không nhận thấy có cộng hưởng 5-hydroxy trong dung môi này.

Bước D: điều chế 4-[[1,3-đimetyl-4-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-điflobenzonitril

Làm nguội dung dịch chứa 1,3-đimetyl-4-(2,4,6-triflophenyl)-1*H*-pyrazol-5-ol (tức là sản phẩm của bước C) (104 mg, 0,43 mmol) trong *N,N*-đimetylformamit khan (2,5 ml) trong bể nước đá dưới khí nitơ, và cho natri hydrua (60% huyền phù trong dầu khoáng, 20 mg, 0,46 mmol) vào làm một lần. Sau 15 phút, cho 3,4,5-triflobenzonitril (101 mg, 0,64 mmol) vào làm một lần. Hỗn hợp phản ứng này được để đạt đến nhiệt độ môi trường, và sau đó hỗn hợp này được gia nhiệt ở nhiệt độ 40 °C trong thời gian 2,5 h. Cho nước (~10 ml) vào, và chiết hỗn hợp này bằng etyl axetat (2 x ~10 ml). Dịch chiết trong etyl axetat hỗn hợp được rửa liên tiếp bằng nước (3 x 10 ml) và nước muối, làm khô (MgSO_4), và cô đặc dưới áp suất giảm. Tiến hành sắc ký trên silicagel (5 g), với rửa giải bằng hỗn hợp của hexan–etyl axetat 2:1, tạo ra sản phẩm (51 mg) chứa hợp chất nêu ở đề mục này ở dạng hỗn hợp theo tỷ lệ 92:8 với chất đồng phân vùng của nó.

^1H NMR δ 7,1 (m, 2H), 6,5–6,6 (m, 2H), 3,85 (s, 3H), 2,05 (s, 3H). MS: 380 amu (AP+).

Ví dụ tổng hợp 7

Điều chế 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin (Hợp chất 240)

Bước A: Điều chế 1-(2-bromo-4-flophenyl)-2-propanon

Trộn dung dịch natri metoxit trong metanol (25%, 34 ml, 157 mmol) với toluen (200 ml). Sau đó, metanol này được cất đi ở nhiệt độ 90 °C bằng cách sử dụng dụng cụ bẫy Dean-Stark. Sau khi làm nguội dung dịch này xuống nhiệt độ 0 °C, cho 2-bromo-4-flobenzenaxetonitril (21,4 g, 100 mmol) đã được hoà tan trong etyl axetat (40 ml) vào từ phễu nhỏ giọt trong thời gian 20 phút đồng thời với khuấy cơ học. Vào thời điểm này, cho thêm toluen (150 ml) vào để tạo thuận lợi cho việc khuấy chất kết tủa màu hồng nhạt có thể tích lớn. Rót hỗn hợp phản ứng này vào nước, và tách pha hữu cơ này ra. Pha nước được axit hoá và chiết bằng etyl axetat. Pha etyl axetat được làm khô và cô đặc dưới áp suất giảm để tạo ra hợp chất trung gian α -axetyl-2-bromo-4-flobenzenaxetonitril dưới dạng dầu thô.

Dầu thô này được hoà tan trong axit sulfuric (60%, 170 ml) và được hồi lưu trong thời gian 6,5 h. Sau đó, chiết hỗn hợp phản ứng này bằng hexan (2 x 100 ml), và dịch chiết trong hexan hỗn hợp được rửa bằng nước và nước muối, làm khô (MgSO₄) và cô đặc dưới áp suất giảm để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng dầu thô màu vàng (14,7 g), chất này được sử dụng trong bước C mà không cần tinh chế thêm.

¹H NMR δ 7,33 (m, 1H), 7,18 (m, 1H), 7,01 (m, 1H), 3,85 (s, 2H), 2,23 (s, 3H).

Bước B: Điều chế 1-clo-3-flo-2-isothiocyantobenzen

Cho carbonothioic điclorua (thiophosgen) (5,1 g, 45 mmol) và DMF (0,27 ml) vào dung dịch chứa 2-clo-6-flobenzenamin (5,0 g, 34 mmol) trong clobenzen (52 ml). Hỗn hợp phản ứng này được hồi lưu trong thời gian 2 h và sau đó cô đặc để lại hợp

chất nêu ở đề mục này dưới dạng dầu màu nâu (6,15 g), chất này được sử dụng trong bước C mà không cần tinh chế thêm.

^1H NMR δ 7,18 (m, 2H), 7,07 (m, 1H).

Bước C: Điều chế 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin

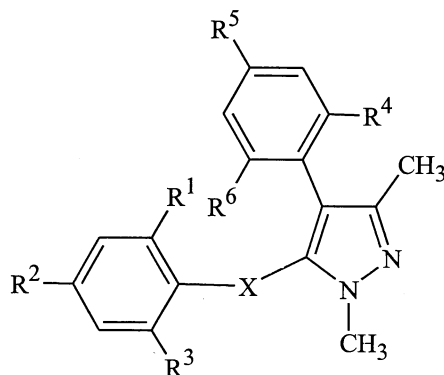
Cho dung dịch chứa 1-(2-bromo-4-flophenyl)-2-propanon (tức là sản phẩm này of bước A) (0,70 g, 3,0 mmol) trong THF (10 ml) vào dung dịch chứa kali *tert*-butoxit (0,41 g, 3,3 mmol) trong THF (20 ml) ở nhiệt độ 0 °C trong thời gian 5 phút. Khuấy tiếp tục trong thời gian 1 h và sau đó giảm nhiệt độ xuống -10 °C. Cho dung dịch chứa 1-clo-3-flo-2-isothioxyanatobenzen (tức là sản phẩm của bước B) (0,57 g, 3,0 mmol) trong THF (10 ml) vào trong thời gian 6 phút, và tiếp tục khuấy trong thời gian 15 phút. Cho iodoxetan (0,54 g, 3,8 mmol) vào, và bể làm lạnh được bỏ ra để tạo ra hỗn hợp phản ứng chứa hợp chất trung gian α -axetyl-2-bromo-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-4-flobenzentanethioamit. Sau 5 phút, cho nước (0,2 ml, 11 mmol), axit axetic băng (0,53 ml, 9,1 mmol) và metylhydrazin (0,81 ml, 15 mmol) vào theo một cách kế tiếp nhanh chóng, và gia nhiệt hỗn hợp phản ứng này đến hồi lưu trong thời gian 6 h. Sau đó, cô đặc hỗn hợp phản ứng thô này dưới áp suất giảm và tinh chế bằng MPLC (0 đến 100% etyl axetat trong hexan dưới dạng dung môi rửa giải) để tạo ra sản phẩm nêu ở tiêu đề, hợp chất theo sáng chế, dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt (0,55 g).

^1H NMR δ 7,24 (m, 1H), 7,04 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 6,87 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 6,68 (m, 1H), 5,45 (d, 1H), 3,80 (s, 3H), 2,10 (s, 3H).

Theo các quy trình được mô tả trong bản mô tả này cùng với các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này, có thể điều chế được các hợp chất được bộc lộ trong các Bảng sau đây. Các từ viết tắt sau đây được dùng trong các Bảng sau đây: Me dùng để chỉ metyl, MeO dùng để chỉ metoxy, EtO dùng để chỉ etoxy, và CN dùng để

chỉ xyano. Do có tính đối xứng, R¹ có thể được thay bằng R³, và R⁴ có thể được thay bằng R⁶, nếu như các định nghĩa R¹, R³, R⁴ và R⁶ cho phép.

Bảng 1



R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là NH.

R ¹	R ²	R ³	R ¹	R ²	R ³
F	H	H	F	H	F
F	F	H	F	F	F
F	CN	F	F	MeO	F
F	EtO	F	F	Cl	H
F	Cl	Cl	F	H	Cl
F	Br	H	F	H	Br
F	Cl	F	F	Br	F
F	I	H	F	F	I
F	I	F	F	CN	H
F	MeO	H	F	EtO	H
Cl	H	H	Cl	H	Cl
Cl	Cl	H	Cl	Cl	Cl
Cl	CN	Cl	Cl	MeO	Cl
Cl	EtO	Cl	Cl	F	H
Cl	F	F	Cl	F	Cl
Cl	Br	H	Cl	H	Br
Cl	Br	Br	Cl	Br	Cl
Cl	I	H	Cl	CN	H
Cl	MeO	H	Cl	EtO	H
Br	H	H	Br	F	H

R ¹	R ²	R ³	R ¹	R ²	R ³
Br	Cl	H	Br	Br	H
Br	F	F	Br	Br	F
Br	Cl	F	Br	F	Cl
Br	Cl	Cl	Br	F	Br
Br	CN	Br	Br	MeO	Br
Br	EtO	Br	Br	CN	H
Br	MeO	H	Br	EtO	H
Br	I	H	I	H	H
I	F	H	I	F	F
I	Cl	F	I	Cl	Cl
Br	H	Cl	Br	H	Br
I	H	F	I	H	Cl
Me	H	H	Me	H	F
Me	F	H	Me	F	F
Me	CN	F	Me	MeO	F
Me	EtO	F	Me	Cl	H
Me	Cl	Cl	Me	H	Cl
Me	Br	H	Me	H	Br
Me	Cl	F	Me	Br	F
Me	I	H	Me	F	I
Me	I	F	Me	CN	H
Me	MeO	H	Me	EtO	H
Me	H	Me	Me	Cl	Me

Sáng chế còn bao gồm các Bảng từ 2 đến 180, mỗi bảng đều có cấu trúc giống như Bảng 1 nêu trên, chỉ khác là tiêu đề hàng trong Bảng 1 (tức là “R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là NH.”) được thay bằng tiêu đề hàng tương ứng như được thể hiện sau đây. Ví dụ, trong Bảng 2 tiêu đề hàng là “R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là F, và X là NH.”, và R⁴, R⁵, và R⁶ là như được xác định trong Bảng 1 nêu trên. Do đó, đề mục đầu tiên trong Bảng 2 cụ thể bộc lộ hợp chất 4-(2,6-điflophenyl)-*N*-(2-flophenyl)-1,3-đimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin).

Bảng	Tiêu đề hàng	Bảng	Tiêu đề hàng
2	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là F, và X là NH.	92	R ⁴ là Cl, R ⁵ là F, R ⁶ là H, và X là O.
3	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là Cl, và X là NH.	93	R ⁴ là Cl, R ⁵ là F, R ⁶ là Cl, và X là O.
4	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là Br, và X là NH.	94	R ⁴ là Cl, R ⁵ là I, R ⁶ là H, và X là O.
5	R ⁴ là F, R ⁵ là Br, R ⁶ là H, và X là NH.	95	R ⁴ là Cl, R ⁵ là EtO, R ⁶ là Cl, và X là O.
6	R ⁴ là F, R ⁵ là Br, R ⁶ là F, và X là NH.	96	R ⁴ là Cl, R ⁵ là EtO, R ⁶ là H, và X là O.
7	R ⁴ là F, R ⁵ là Cl, R ⁶ là Cl, và X là NH.	97	R ⁴ là Cl, R ⁵ là MeO, R ⁶ là Cl, và X là O.
8	R ⁴ là F, R ⁵ là Cl, R ⁶ là F, và X là NH.	98	R ⁴ là Cl, R ⁵ là MeO, R ⁶ là H, và X là O.
9	R ⁴ là F, R ⁵ là Cl, R ⁶ là H, và X là NH.	99	R ⁴ là Br, R ⁵ là H, R ⁶ là H, và X là O.
10	R ⁴ là F, R ⁵ là -CN, R ⁶ là F, và X là NH.	100	R ⁴ là Br, R ⁵ là Br, R ⁶ là H, và X là O.
11	R ⁴ là F, R ⁵ là -CN, R ⁶ là H, và X là NH.	101	R ⁴ là Br, R ⁵ là Br, R ⁶ là F, và X là O.
12	R ⁴ là F, R ⁵ là F, R ⁶ là H, và X là NH.	102	R ⁴ là Br, R ⁵ là Cl, R ⁶ là H, và X là O.
13	R ⁴ là F, R ⁵ là F, R ⁶ là F, và X là NH.	103	R ⁴ là Br, R ⁵ là Cl, R ⁶ là F, và X là O.
14	R ⁴ là F, R ⁵ là F, R ⁶ là I, và X là NH.	104	R ⁴ là Br, R ⁵ là Cl, R ⁶ là Cl, và X là O.
15	R ⁴ là F, R ⁵ là I, R ⁶ là H, và X là NH.	105	R ⁴ là Br, R ⁵ là CN, R ⁶ là Br, và X là O.
16	R ⁴ là F, R ⁵ là I, R ⁶ là F, và X là NH.	106	R ⁴ là Br, R ⁵ là CN, R ⁶ là H, và X là O.
17	R ⁴ là F, R ⁵ là EtO, R ⁶ là F, và X là NH.	107	R ⁴ là Br, R ⁵ là F, R ⁶ là F, và X là O.
18	R ⁴ là F, R ⁵ là EtO, R ⁶ là H, và X là NH.	108	R ⁴ là Br, R ⁵ là F, R ⁶ là H, và X là O.
19	R ⁴ là F, R ⁵ là MeO, R ⁶ là F, và X là NH.	109	R ⁴ là Br, R ⁵ là F, R ⁶ là Cl, và X là O.
20	R ⁴ là F, R ⁵ là MeO, R ⁶ là H, và X là NH.	110	R ⁴ là Br, R ⁵ là F, R ⁶ là Br, và X là O.
21	R ⁴ là Cl, R ⁵ là H, R ⁶ là H, và X là NH.	111	R ⁴ là Br, R ⁵ là I, R ⁶ là H, và X là O.
22	R ⁴ là Cl, R ⁵ là H, R ⁶ là Cl, và X là NH.	112	R ⁴ là Br, R ⁵ là EtO, R ⁶ là Br, và X là O.
23	R ⁴ là Cl, R ⁵ là H, R ⁶ là Br, và X là NH.	113	R ⁴ là Br, R ⁵ là EtO, R ⁶ là H, và X là O.
24	R ⁴ là Cl, R ⁵ là Br, R ⁶ là H, và X là NH.	114	R ⁴ là Br, R ⁵ là MeO, R ⁶ là Br, và X là O.
25	R ⁴ là Cl, R ⁵ là Br, R ⁶ là Br, và X là NH.	115	R ⁴ là Br, R ⁵ là MeO, R ⁶ là H, và X là O.
26	R ⁴ là Cl, R ⁵ là Br, R ⁶ là Cl, và X là NH.	116	R ⁴ là I, R ⁵ là H, R ⁶ là H, và X là O.
27	R ⁴ là Cl, R ⁵ là Cl, R ⁶ là H, và X là NH.	117	R ⁴ là I, R ⁵ là Cl, R ⁶ là F, và X là O.
28	R ⁴ là Cl, R ⁵ là Cl, R ⁶ là Cl, và X là NH.	118	R ⁴ là I, R ⁵ là Cl, R ⁶ là Cl, và X là O.
29	R ⁴ là Cl, R ⁵ là -CN, R ⁶ là Cl, và X là NH.	119	R ⁴ là I, R ⁵ là F, R ⁶ là H, và X là O.
30	R ⁴ là Cl, R ⁵ là -CN, R ⁶ là H, và X là NH.	120	R ⁴ là I, R ⁵ là F, R ⁶ là F, và X là O.
31	R ⁴ là Cl, R ⁵ là F, R ⁶ là F, và X là NH.	121	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là H, và X là CHOH.
32	R ⁴ là Cl, R ⁵ là F, R ⁶ là H, và X là NH.	122	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là F, và X là CHOH.
33	R ⁴ là Cl, R ⁵ là F, R ⁶ là Cl, và X là NH.	123	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là Cl, và X là CHOH.
34	R ⁴ là Cl, R ⁵ là I, R ⁶ là H, và X là NH.	124	R ⁴ là F, R ⁵ là H, R ⁶ là Br, và X là CHOH.
35	R ⁴ là Cl, R ⁵ là EtO, R ⁶ là Cl, và X là NH.	125	R ⁴ là F, R ⁵ là Br, R ⁶ là H, và X là CHOH.
36	R ⁴ là Cl, R ⁵ là EtO, R ⁶ là H, và X là NH.	126	R ⁴ là F, R ⁵ là Br, R ⁶ là F, và X là CHOH.
37	R ⁴ là Cl, R ⁵ là MeO, R ⁶ là Cl, và X là NH.	127	R ⁴ là F, R ⁵ là Cl, R ⁶ là Cl, và X là CHOH.
38	R ⁴ là Cl, R ⁵ là MeO, R ⁶ là H, và X là NH.	128	R ⁴ là F, R ⁵ là Cl, R ⁶ là F, và X là CHOH.

- 39 R⁴ là Br, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là NH.
 40 R⁴ là Br, R⁵ là Br, R⁶ là H, và X là NH.
 41 R⁴ là Br, R⁵ là Br, R⁶ là F, và X là NH.
 42 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là H, và X là NH.
 43 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là F, và X là NH.
 44 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là Cl, và X là NH.
 45 R⁴ là Br, R⁵ là -CN, R⁶ là Br, và X là NH.
 46 R⁴ là Br, R⁵ là -CN, R⁶ là H, và X là NH.
 47 R⁴ là Br, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là NH.
 48 R⁴ là Br, R⁵ là F, R⁶ là H, và X là NH.
 49 R⁴ là Br, R⁵ là F, R⁶ là Cl, và X là NH.
 50 R⁴ là Br, R⁵ là F, R⁶ là Br, và X là NH.
 51 R⁴ là Br, R⁵ là I, R⁶ là H, và X là NH.
 52 R⁴ là Br, R⁵ là EtO, R⁶ là Br, và X là NH.
 53 R⁴ là Br, R⁵ là EtO, R⁶ là H, và X là NH.
 54 R⁴ là Br, R⁵ là MeO, R⁶ là Br, và X là NH.
 55 R⁴ là Br, R⁵ là MeO, R⁶ là H, và X là NH.
 56 R⁴ là I, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là NH.
 57 R⁴ là I, R⁵ là Cl, R⁶ là F, và X là NH.
 58 R⁴ là I, R⁵ là Cl, R⁶ là Cl, và X là NH.
 59 R⁴ là I, R⁵ là F, R⁶ là H, và X là NH.
 60 R⁴ là I, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là NH.
 61 R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là O.
 62 R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là F, và X là O.
 63 R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là Cl, và X là O.
 64 R⁴ là F, R⁵ là H, R⁶ là Br, và X là O.
 65 R⁴ là F, R⁵ là Br, R⁶ là H, và X là O.
 66 R⁴ là F, R⁵ là Br, R⁶ là F, và X là O.
 67 R⁴ là F, R⁵ là Cl, R⁶ là Cl, và X là O.
 68 R⁴ là F, R⁵ là Cl, R⁶ là F, và X là O.
 69 R⁴ là F, R⁵ là Cl, R⁶ là H, và X là O.
 70 R⁴ là F, R⁵ là CN, R⁶ là F, và X là O.
 71 R⁴ là F, R⁵ là CN, R⁶ là H, và X là O.
 72 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là H, và X là O.
 73 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là O.
 74 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là I, và X là O.
 75 R⁴ là F, R⁵ là I, R⁶ là H, và X là O.
 76 R⁴ là F, R⁵ là I, R⁶ là F, và X là O.
 77 R⁴ là F, R⁵ là EtO, R⁶ là F, và X là O.
 129 R⁴ là F, R⁵ là Cl, R⁶ là H, và X là CHOH.
 130 R⁴ là F, R⁵ là CN, R⁶ là F, và X là CHOH.
 131 R⁴ là F, R⁵ là CN, R⁶ là H, và X là CHOH.
 132 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là H, và X là CHOH.
 133 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là CHOH.
 134 R⁴ là F, R⁵ là F, R⁶ là I, và X là CHOH.
 135 R⁴ là F, R⁵ là I, R⁶ là H, và X là CHOH.
 136 R⁴ là F, R⁵ là I, R⁶ là F, và X là CHOH.
 137 R⁴ là F, R⁵ là EtO, R⁶ là F, và X là CHOH.
 138 R⁴ là F, R⁵ là EtO, R⁶ là H, và X là CHOH.
 139 R⁴ là F, R⁵ là MeO, R⁶ là F, và X là CHOH.
 140 R⁴ là F, R⁵ là MeO, R⁶ là H, và X là CHOH.
 141 R⁴ là Cl, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là CHOH.
 142 R⁴ là Cl, R⁵ là H, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 143 R⁴ là Cl, R⁵ là H, R⁶ là Br, và X là CHOH.
 144 R⁴ là Cl, R⁵ là Br, R⁶ là H, và X là CHOH.
 145 R⁴ là Cl, R⁵ là Br, R⁶ là Br, và X là CHOH.
 146 R⁴ là Cl, R⁵ là Br, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 147 R⁴ là Cl, R⁵ là Cl, R⁶ là H, và X là CHOH.
 148 R⁴ là Cl, R⁵ là Cl, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 149 R⁴ là Cl, R⁵ là CN, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 150 R⁴ là Cl, R⁵ là CN, R⁶ là H, và X là CHOH.
 151 R⁴ là Cl, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là CHOH.
 152 R⁴ là Cl, R⁵ là F, R⁶ là H, và X là CHOH.
 153 R⁴ là Cl, R⁵ là F, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 154 R⁴ là Cl, R⁵ là I, R⁶ là H, và X là CHOH.
 155 R⁴ là Cl, R⁵ là EtO, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 156 R⁴ là Cl, R⁵ là EtO, R⁶ là H, và X là CHOH.
 157 R⁴ là Cl, R⁵ là MeO, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 158 R⁴ là Cl, R⁵ là MeO, R⁶ là H, và X là CHOH.
 159 R⁴ là Br, R⁵ là H, R⁶ là H, và X là CHOH.
 160 R⁴ là Br, R⁵ là Br, R⁶ là H, và X là CHOH.
 161 R⁴ là Br, R⁵ là Br, R⁶ là F, và X là CHOH.
 162 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là H, và X là CHOH.
 163 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là F, và X là CHOH.
 164 R⁴ là Br, R⁵ là Cl, R⁶ là Cl, và X là CHOH.
 165 R⁴ là Br, R⁵ là CN, R⁶ là Br, và X là CHOH.
 166 R⁴ là Br, R⁵ là CN, R⁶ là H, và X là CHOH.
 167 R⁴ là Br, R⁵ là F, R⁶ là F, và X là CHOH.

78	R^4 là F, R^5 là EtO, R^6 là H, và X là O.	168	R^4 là Br, R^5 là F, R^6 là H, và X là CHOH.
79	R^4 là F, R^5 là MeO, R^6 là F, và X là O.	169	R^4 là Br, R^5 là F, R^6 là Cl, và X là CHOH.
80	R^4 là F, R^5 là MeO, R^6 là H, và X là O.	170	R^4 là Br, R^5 là F, R^6 là Br, và X là CHOH.
81	R^4 là Cl, R^5 là H, R^6 là H, và X là O.	171	R^4 là Br, R^5 là I, R^6 là H, và X là CHOH.
82	R^4 là Cl, R^5 là H, R^6 là Cl, và X là O.	172	R^4 là Br, R^5 là EtO, R^6 là Br, và X là CHOH.
83	R^4 là Cl, R^5 là H, R^6 là Br, và X là O.	173	R^4 là Br, R^5 là EtO, R^6 là H, và X là CHOH.
84	R^4 là Cl, R^5 là Br, R^6 là H, và X là O.	174	R^4 là Br, R^5 là MeO, R^6 là Br, và X là CHOH.
85	R^4 là Cl, R^5 là Br, R^6 là Br, và X là O.	175	R^4 là Br, R^5 là MeO, R^6 là H, và X là CHOH.
86	R^4 là Cl, R^5 là Br, R^6 là Cl, và X là O.	176	R^4 là I, R^5 là H, R^6 là H, và X là CHOH.
87	R^4 là Cl, R^5 là Cl, R^6 là H, và X là O.	177	R^4 là I, R^5 là Cl, R^6 là F, và X là CHOH.
88	R^4 là Cl, R^5 là Cl, R^6 là Cl, và X là O.	178	R^4 là I, R^5 là Cl, R^6 là Cl, và X là CHOH.
89	R^4 là Cl, R^5 là CN, R^6 là Cl, và X là O.	179	R^4 là I, R^5 là F, R^6 là H, và X là CHOH.
90	R^4 là Cl, R^5 là CN, R^6 là H, và X là O.	180	R^4 là I, R^5 là F, R^6 là F, và X là CHOH.
91	R^4 là Cl, R^5 là F, R^6 là F, và X là O.		

Chế phẩm/tính hữu ích

Hợp chất được chọn từ hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, và muối của nó, hoặc hỗn hợp (tức là chế phẩm) chứa hợp chất này với ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung như mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, thường sẽ được dùng để tạo ra hoạt chất diệt nấm trong các chế phẩm tiếp theo, tức là thuốc trừ nấm, với ít nhất một thành phần nữa được chọn từ nhóm gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, đóng vai trò là chất mang. Chế phẩm hoặc các thành phần của chế phẩm được lựa chọn sao cho phù hợp với tính chất vật lý của thành phần hoạt tính, cách thức dùng và các yếu tố môi trường chẳng hạn như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Hỗn hợp gồm hợp phần (a) (tức là ít nhất một hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, hoặc muối của nó) với hợp phần (b) (ví dụ, được chọn từ (b1) đến (b46) và muối của nó như đã nêu trên) và/hoặc một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác (tức là các thuốc trừ sâu, các thuốc diệt nấm khác, các thuốc diệt giun tròn, các thuốc diệt ve bét, các thuốc diệt cỏ và các tác nhân sinh học khác) có thể được chế hóa theo một số cách, bao gồm:

(i) hợp phần (a), hợp phần (b) và/hoặc một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể được chế hóa riêng rẽ và được dùng riêng rẽ

hoặc được dùng đồng thời với tỷ lệ khối lượng thích hợp, ví dụ, dung dịch hỗn hợp trong thùng; hoặc

(ii) hợp phần (a), hợp phần (b) và/hoặc một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể được chế hóa cùng nhau với tỷ lệ khối lượng thích hợp.

Các chế phẩm hữu dụng bao gồm cả các hỗn hợp lỏng và rắn.

Các hỗn hợp lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Loại hỗn hợp lỏng chứa nước nói chung là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc huyền phù, huyền phù viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương và nhũ tương-huyền phù. Loại hỗn hợp lỏng không chứa nước nói chung là dạng cô đặc có thể nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

Loại hỗn hợp rắn nói chung là dạng bột mịn để rắc khô, bột, hạt, viên tròn, viên tròn, viên hình thoi, viên nén, dạng màng bao (bao gồm các lớp phủ hạt) và các dạng tương tự, có thể là dễ phân tán trong nước (“thấm ướt”) hoặc tan trong nước. Các lớp màng và các lớp phủ được tạo ra từ các dung dịch tạo màng hoặc huyền phù để chảy đặc biệt hữu ích dùng để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao (vi) nang và còn được tạo thành huyền phù hoặc chế phẩm rắn; theo cách khác, toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc “được bao”). Việc bao nang có thể phòng trừ hoặc làm chậm quá trình giải phóng hoạt chất. Hạt có thể nhũ hóa kết hợp được các ưu điểm của cả chế phẩm dạng cô đặc có thể nhũ hóa và chế phẩm dạng hạt khô. Các hỗn hợp đậm đặc được sử dụng chủ yếu làm chất trung gian dùng để pha chế tiếp.

Đáng lưu ý là một phương án chế phẩm trong đó hạt chế phẩm rắn chứa hợp chất có công thức 1 (hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng) được trộn với hạt chế phẩm rắn chứa hợp phần (b). Các hỗn hợp này có thể còn được trộn với hạt chứa các chất bảo vệ dùng trong nông nghiệp bổ sung. Theo cách khác, hai hoặc nhiều chất bảo vệ dùng trong nông nghiệp (ví dụ, hợp chất hợp phần (a) (Công thức 1), hợp chất hợp

phần (b), chất bảo vệ dùng trong nông nghiệp không phải là hợp phần (a) hoặc (b)) có thể kết hợp với nhau trong chế phẩm rắn gồm một tập hợp các hạt, sau đó tập hợp các hạt này được trộn với một hoặc nhiều tập hợp các hạt chế phẩm rắn chứa một hoặc nhiều chất bảo vệ dùng trong nông nghiệp bổ sung. Có thể tạo ra hỗn hợp các hạt này theo phương pháp tạo hỗn hợp chung được bộc lộ trong công bố đơn PCT WO 94/24861 hoặc tốt hơn nữa nếu là hướng dẫn tạo hỗn hợp hạt đồng nhất nêu trong patent Mỹ 6,022,552.

Các chế phẩm phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Các chế phẩm lỏng và rắn như vậy được bào chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước. Các thể tích phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thông thường hơn, nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Các chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Các chế phẩm lỏng và khô có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được đưa lên thực vật hạt làm chất xử lý hạt trước khi gieo trồng để bảo vệ rễ đang phát triển và các bộ phận khác dưới mặt đất của thực vật và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thụ nội hấp.

Các chế phẩm sẽ thường chứa lượng hữu hiệu hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong khoảng gần đúng sau đây để tổng lượng là 100 phần trăm trọng lượng.

	Phần trăm trọng lượng		
	Hoạt chất	Chất pha loãng	Chất hoạt động bề mặt
Hạt, viên nén và bột phân tán trong nước và tan trong nước	0,001-90	0-99,999	1-15
Huyền phù, nhũ tương, dung dịch dầu (kể cả chất cô đặc có thể nhũ hoá)	1-50	40-99	0-15
Bột mịn	1-25	70-99	0-5
Hạt và viên tròn	0,001-99	5-99,999	0-15
Hỗn hợp đậm đặc	90-99	0-10	0-2

Chất pha loãng rắn bao gồm, ví dụ, đất sét như bentonit, montmorillonit, attapulgit và kaolanh, thạch cao, xenluloza, titan đioxit, kẽm oxit, tinh bột, đextrin, đường (ví dụ lactoza, sucroza), silic oxit, bột bột talc, mica, đất tảo silic, ure, canxi cacbonat, natri cacbonat và bicarbonat, và natri sulfat. Chất pha loãng rắn thông thường được mô tả trong Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents và Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Chất pha loãng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-đimetylalkanamit (ví dụ *N,N*-đimetylformamit), limonen, đimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyrrolidôn (ví dụ *N*-metylpyrrolidinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen cacbonat, butylen cacbonat, parafin (Ví dụ dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, các hydrocacbon thơm, các chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, các keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như các este lactat alkylat hóa, các este đibazơ và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà, như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-ethylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, lauryl

rượu, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, diaxeton rượu và rượu benzyl. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là C₆–C₂₂), như các dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), các chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các axit béo alkylat hóa (ví dụ được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng chưng cất. Chất pha loãng lỏng thông thường được mô tả trong Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Các hỗn hợp rắn và lỏng theo sáng chế thường bao gồm một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt thường biến đổi, thường làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Tùy thuộc vào bản chất của các nhóm ưa nước và ưa chất béo trong phân tử chất hoạt động bề mặt, có thể sử dụng chất hoạt động bề mặt làm các chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hoá hoặc các chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại dưới dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu dụng đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: rượu alkoxylat như rượu alkoxylat trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit etoxylat hóa; triglyxerit alkoxylat hóa như đậu tương etoxylat hóa, các dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, đinonyl phenol etoxylat và đodexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các polyme khối được điều chế từ etylen oxit hoặc propylen oxit và các polyme khối ngược, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen oxit; các

axit béo etoxylat hóa; các este béo và các dầu etoxylat hóa; các metyl este etoxylat hóa; tristyrylphenol etoxylat hóa (bao gồm các loại được điều chế từ etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất trên cơ sở lanolin, các este polyetoxylat như các este sorbitan axit béo polyetoxoxy hoá, các este sorbitol axit béo polyetoxoxy hoá và các este glyxerol axit béo polyetoxoxy hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyl (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở silicon; và dẫn xuất của đường như các este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysacarit.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu dụng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và muối của chúng; rượu carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất diphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc succinic hoặc các anhydrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của alkoxylat rượu, các este phosphat của alkylphenol alkoxylat và các este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở protein; các dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N,N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và dodecyl và tridecylbenzen; các sulfonat của naphtalen được ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cất phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và các dẫn xuất của chúng như các muối dialkyl sulfosuccinat.

Chất hoạt động bề mặt cation hữu dụng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các amit và các amit etoxylat hóa; các amin như *N*-alkyl propandiamin, tripropylentriamin và dipropylentetramin, và các amin etoxylat hóa, các điamin

etoxylat hóa và các amin propoxylat hóa (được điều chế từ các amin và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các muối amin như amin axetat và các muối điamin; các muối amoni bậc bốn như muối bậc bốn, các muối bậc bốn và các muối được tạo bậc bốn hai lần etoxylat hóa; và amin oxit như alkylđimetylamin oxit và bis-(2-hydroxyetyl)-alkylamin oxit.

Cũng hữu dụng đối với các hỗn hợp này là các hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions, xuất bản McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; và A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Hỗn hợp theo sáng chế có thể còn chứa chế phẩm chất bổ trợ và các chất phụ gia, đã biết đối với các chuyên gia trong lĩnh vực làm chất trợ bào chế. Chất bổ trợ và các chất phụ gia như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (các chất đệm), sự tạo bọt trong quá trình xử lý (các chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), sự lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong dụng cụ chứa (các chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (các chất chống đông), màu sắc (các chất phân tán tạo màu/thuốc nhuộm), sự rửa trôi (các chất tạo màng hoặc các chất dính), sự bay hơi (các chất làm chậm bay hơi), và các chế phẩm khác tương tự. Các chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat, các rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và các sáp. Ví dụ về chất bổ trợ và các chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm các chất được liệt kê trong *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và bắc Mỹ do

McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. công bố; và công bố đơn PCT WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được kết hợp trong các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc có thể nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc có thể nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2.000 μm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới đây 3 μm . Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành huyền phù dạng cô đặc (ví dụ xem U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để tạo ra hạt phân tán trong nước. Các chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10 μm . Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên các chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, trang 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và các trang tiếp theo, và WO 91/13546. Các viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Các hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các cách bào chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern

Agriculture” trong *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks và T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, trang. 120–133. Cũng xem U.S. 3,235,361, Cột 6, các dòng từ 16 đến Cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Cột 5, dòng 43 đến Cột 7, dòng 62 và Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến Cột 5, dòng 17 và Ví dụ 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley và Sons, Inc., New York, 1961, trang 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

Trong các ví dụ sau, tất cả phần trăm đều tính theo khối lượng và tất cả các chế phẩm đều được điều chế theo cách thông thường. Các số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong các bảng phụ lục từ A. Không cần mô tả kỹ hơn, các tác giả sáng chế cho rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng phần mô tả trên của sáng chế với phạm vi rộng nhất. Do đó, các ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh họa sáng chế và không hạn chế phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Phần trăm được tính theo khối lượng chỉ khác là có quy định khác.

Ví dụ A

Dịch cô đặc nồng độ cao

Hợp chất 47	49,3%
penthiopyrad	49,2%
gel khí silic đioxit	0,5%
silic đioxit mịn tổng hợp vô định hình	1,0%

Ví dụ B

Bột thấm ướt

Hợp chất 81	43,0%
quinoxifen	22,0%
đodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
montmorillonit (được nung khô)	23,0%

Ví dụ C

Hạt

Hợp chất 136	7,5%
epoxiconazole	2,5%
hạt atapulgit (chất ít bay hơi, 0,71/0,30 mm; rây U.S.S. số 25–50)	90,0%

Ví dụ D

Viên ép đùn

Hợp chất 144	8,0%
spiroxamin	17,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ E

Dịch đặc nhũ hóa được

Hợp chất 161	5,0%
azoxystrobin	5,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
este metyl của axit béo C ₆ –C ₁₀	70,0%

Ví dụ F

Vi nhũ tương

Hợp chất 195	3,3%
picoxystrobin	1,7%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	30,0%
alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
Nước	20,0%

Ví dụ G

Xử lý hạt giống

Hợp chất 238	4,00%
iprodione	16,00%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	5,00%
sáp montan axit	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%
copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
ruợu stearyllic (POE 20)	2,00%
polyorganosilan	0,20%
phẩm nhuộm màu đỏ	0,05%
nước	65,75%

Ví dụ H

Dịch đặc nhũ hóa được

Hợp chất 239	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
este metyl của axit béo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Các chế phẩm chẳng hạn như các chế phẩm trong Bảng chế phẩm thường được pha loãng với nước để tạo ra chế phẩm nước trước khi dùng. Chế phẩm nước để dùng trực tiếp lên thực vật hoặc bộ phận của nó (ví dụ, chế phẩm dùng trong thùng

phun xịt) thường chứa ít nhất khoảng 1 ppm hoặc nhiều hơn (ví dụ, từ 1 ppm đến 100 ppm) hoạt chất diệt nấm theo sáng chế.

Ví dụ về các hợp chất diệt nấm hợp phần (b) bao gồm acibenzolar-*S*-metyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, bethoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blastidicin-*S*, boscalid, bromuconazole, bupirimate, buthiobate, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, chlozolate, clotrimazole, các muối đồng chẳng hạn như hỗn hợp Bordeaux (trixit đồng sulfat), đồng hydroxit và đồng oxyclorea, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, diflumetorim, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, diniconazole-M, dinocap, dithianon, dodemorph, dodine, edifenphos, enestroburin, epoxiconazole, etaconazole, ethaboxam, ethirimol, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil, fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin clorea, fentin hydroxit, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluopicolide (còn được biết đến là picobenzamid), fluopyram, fluoroimide, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutianil (2-[[2-flu-5-(triflometyl)phenyl]thio]-2-[3-(2-metoxypheyl)-2-thiazolidinyliden]axetonitril), flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fosetyl-nhôm, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, hexaconazole, hymexazol, guazatine, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iodocarb, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl, metalaxyl-M, metconazole, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, mepanipyrim, metrafenone, myclobutanil, naftifine, neo-asozin (sắt (III) metanarsonat), nuarimol, octhilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, oxolinic axit, oxpoconazole, oxycarboxin, oxytetracyclin, penconazole, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, pefurazoate, axit

phosphor và muối của chúng, phthalide, picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propamocarb-hydroclorua, propiconazole, propineb, proquinazid, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributicarb, pyrifenox, pyrimethanil, pyriofenone, pyroquilon, pyrrolnitrin, quinconazole, quinomethionate, quinoxifen, quintozone, sedaxane, silthiofam, simeconazole, spiroxamin, streptomycin, sulfur, tebuconazole, tebufloquin, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate, thiophanate-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxide, tricyclazole, tridemorph, triflumizole, tricyclazole, trifloxystrobin, triforine, trimorphamide, triticonazole, uniconazole, validamycin, valifenalate (valiphenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamide, *N*'-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit, 5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-metylpiiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin (BAS600), *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphephenyl]etyl]-3-metyl-2-[(metylsulfonyl)-amino]butanamit, *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphephenyl]etyl]-3-metyl-2-[(etylulfonyl)amino]butanamit, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-on, 3-[5-(4-clophenyl)-2,3-đimetyl-3-isoxazolidinyl]pyridin, 4-flophenyl *N*-[1-[[[1-(4-xyanophenyl)etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbamam, *N*-[[[(xyclopropylmetoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]metylen]-benzenaxetamit, α -(metoxyimino)-*N*-metyl-2-[[[1-[3-(triflometyl)phenyl]etoxy]-imino]metyl]benzenaxetamit, *N*'-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit, *N*-(4-clo-2-nitrophenyl)-*N*-etyl-4-metylbenzen-sulfonamit, 2-[[[[3-(2,6-điclophenyl)-1-metyl-2-propen-1-yliden]amino]oxy]metyl]- α -(metoxyimino)-*N*-metylbenzenaxetamit, 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-metyletyl)-4-(2-metylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-on, etyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin-7-ylamin, pentyl *N*-[4-[[[(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmetylen]-amino]oxy]metyl]-2-thiazolyl]carbamam, pentyl *N*-[6-[[[(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)-phenylmetylen]amino]oxy]metyl]-2-pyridinyl]carbamam, 2-[(3-bromo-6-quinoliny)-oxy]-*N*-(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-(metylthio)axetamit, 2-[(3-etynyl-6-quinoliny)-

oxy]-*N*-[1-(hydroxymetyl)-1-metyl-2-propyn-1-yl]-2-(metylthio)axetamit, *N*-(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-[(3-etynyl-6-quinolinyloxy)-2-(metylthio)axetamit và *N'*-[4-[[3-[(4-clophenyl)metyl]-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit. đáng lưu ý is the preceding list also excluding *N'*-[4-[[3-[(4-clophenyl)metyl]-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-đimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit. Of further note is the preceding list also excluding buthiobate, etaconazole, quinconazole, triarimol, 2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)-*N*-(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-(metylthio)axetamit, 2-[(3-etynyl-6-quinolinyloxy)-*N*-[1-(hydroxymetyl)-1-metyl-2-propyn-1-yl]-2-(metylthio)axetamit và *N*-(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-[(3-etynyl-6-quinolinyloxy)-2-(metylthio)axetamit.

Đáng lưu ý là các hợp chất diệt nấm trong hợp phần (b) của chế phẩm theo sáng chế là azoxystrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, picoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, carbendazim, chlorothalonil, quinoxifen, metrafenone, pyriofenone, cyflufenamid, fenpropidin, fenpropimorph, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, flusilazole, fluxapyroxad, hexaconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, tebuconazole, triticonazole, famoxadone, prochloraz, penthiopyrad và boscalid (nicobifen).

Được ưu tiên phổ biến hơn để cho tác dụng phòng trừ tốt hơn các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra (ví dụ, mức độ dùng thấp hơn hoặc phổ các sinh vật gây bệnh thực vật rộng hơn được phòng trừ) hoặc quản lý tính kháng thuốc là hỗn hợp của hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, hoặc muối của chúng, với hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm: azoxystrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, picoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, quinoxifen, metrafenone, cyflufenamid, fenpropidin, fenpropimorph, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, etaconazole, flusilazole, metconazole, myclobutanil, propiconazole, proquinazid,

prothioconazole, pyriofenone, tebuconazole, triticonazole, famoxadone và penthiopyrad.

Trong các chế phẩm diệt nấm theo sáng chế, hợp phần (a) (tức là ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, và muối của chúng) và hợp phần (b) có mặt với một lượng hữu hiệu diệt nấm. Tỷ lệ khối lượng của hợp phần (b) (tức là một hoặc nhiều hợp chất diệt nấm bổ sung) với hợp phần (a) thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1, và thông thường hơn nằm trong khoảng từ 1:500 đến 500:1. Bảng B1 liệt kê các khoảng tỷ lệ thông thường, thông thường hơn và thông thường nhất liên quan đến hợp chất diệt nấm cụ thể là hợp phần (b). Các Bảng A1 đến A43 và C1 đến C43 đưa ra ví dụ tỷ lệ khối lượng cho các kết hợp cụ thể của các hợp chất diệt nấm. Đáng lưu ý là các chế phẩm trong đó tỷ lệ khối lượng của hợp phần (a) so với hợp phần (b) nằm trong khoảng từ 125:1 đến khoảng 1:125. Với nhiều hợp chất diệt nấm thuộc hợp phần (b), các chế phẩm này là đặc biệt hữu hiệu phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra. Được quan tâm đặc biệt là các chế phẩm trong đó tỷ lệ khối lượng của hợp phần (a) so với hợp phần (b) nằm trong khoảng từ 25:1 đến 1:25, hoặc nằm trong khoảng từ 5:1 đến 1:5. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng thông qua thử nghiệm đơn giản tỷ lệ khối lượng và mức dùng các hợp chất diệt nấm cần thiết để cho phổ bảo vệ và phòng trừ nấm mong muốn. Sẽ chứng tỏ được rằng việc đưa thêm các hợp chất diệt nấm bổ sung trong hợp phần (b) may có thể mở rộng phạm vi các bệnh cho thực vật được phòng trừ ngoài phạm vi được phòng trừ khi chỉ dùng hợp phần (a).

Các hỗn hợp cụ thể (số hợp chất dùng để chỉ hợp chất trong Bảng phụ lục A) được đưa ra trong các Bảng A1 đến A43. Trong Bảng A1, mỗi dòng ở phía dưới tiêu đề cột “Hợp phần (a)” và “Hợp phần (b)” bộc lộ cụ thể hỗn hợp gồm Hợp phần (a), là Hợp chất 3, với hợp chất diệt nấm Hợp phần (b). Các thông số ở phía dưới tiêu đề “Tỷ lệ minh hoạ” đưa ra ba tỷ lệ khối lượng cụ thể của Hợp phần (b) so với Hợp phần (a) cho hỗn hợp được bộc lộ. Ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng A1 bộc lộ hỗn hợp gồm Hợp

chất 3 với acibenzolar-*S*-metyl và liệt kê tỷ lệ khối lượng của acibenzolar-*S*-metyl so với Hợp chất 3 là 1:1, 1:4 hoặc 1:18.

Bảng A1

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	acibenzolar- <i>S</i> -metyl	1:1	1:4	1:18
Hợp chất 3	aldimorph	7:1	3:1	1:1
Hợp chất 3	ametoctradin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	amisulbrom	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	anilazine	22:1	8:1	4:1
Hợp chất 3	azaconazole	2:1	1:2	1:4
Hợp chất 3	azoxystrobin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	benalaxyl	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	benalaxyl-M	1:1	1:3	1:8
Hợp chất 3	benodanil	4:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	benomyl	11:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	benthiavalicarb	1:1	1:4	1:12
Hợp chất 3	benthiavalicarb-isopropyl	1:1	1:4	1:12
Hợp chất 3	bethoxazin	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	binapacryl	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	biphenyl	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	bitertanol	3:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	bixafen	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	blastidicin-S	1:4	1:12	1:30
Hợp chất 3	Hỗn hợp Bordeaux (triazit đồng sulfat)	45:1	15:1	5:1
Hợp chất 3	boscalid	4:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	bromuconazole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	bupirimate	1:3	1:10	1:30
Hợp chất 3	captafol	15:1	5:1	2:1

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	captan	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	carbendazim	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	carboxin	4:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	carpropamid	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	chloroneb	100:1	35:1	14:1
Hợp chất 3	chlorothalonil	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	chlozolate	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	clotrimazole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	đồng hydroxit	45:1	15:1	5:1
Hợp chất 3	đồng oxyclorea	45:1	15:1	5:1
Hợp chất 3	cyazofamid	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	cyflufenamid	1:2	1:6	1:24
Hợp chất 3	cymoxanil	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	cyproconazole	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	cyprodinil	4:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	dichlofluanid	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	diclocymet	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	diclomezine	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	dicloran	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	diethofencarb	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	difenoconazole	1:1	1:3	1:12
Hợp chất 3	diflumetorim	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	dimethirimol	1:3	1:8	1:30
Hợp chất 3	dimethomorph	3:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	dimoxystrobin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	diniconazole	1:1	1:3	1:8
Hợp chất 3	diniconazole-M	1:1	1:3	1:12
Hợp chất 3	dinocap	2:1	1:1	1:3

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	dithianon	5:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	dodemorph	7:1	3:1	1:1
Hợp chất 3	dodine	10:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	edifenphos	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	enestroburin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	epoxiconazole	1:1	1:3	1:7
Hợp chất 3	etaconazole	1:1	1:3	1:7
Hợp chất 3	ethaboxam	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	ethirimol	7:1	3:1	1:1
Hợp chất 3	etridiazole	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	famoxadone	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	fenamidone	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	fenarimol	1:2	1:7	1:24
Hợp chất 3	fenbuconazole	1:1	1:3	1:10
Hợp chất 3	fenfuram	4:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	fenhexamid	10:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	fenoxanil	15:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	fenpiclonil	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	fenpropidin	7:1	2:1	1:1
Hợp chất 3	fenpropimorph	7:1	2:1	1:1
Hợp chất 3	fenpyrazamin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	muối fentin chẳng hạn như fentin axetat, fentin clorua hoặc fentin hydroxit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	ferbam	30:1	10:1	4:1
Hợp chất 3	ferimzone	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	fluazinam	3:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	fludioxonil	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	flumetover	3:1	1:1	1:2

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	flumorph	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	fluopicolide	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	fluopyram	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	fluoroimide	37:1	14:1	5:1
Hợp chất 3	fluoxastrobin	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	fluquinconazole	1:1	1:2	1:4
Hợp chất 3	flusilazole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	flusulfamide	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	flutianil	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	flutolanil	4:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	flutriafol	1:1	1:2	1:4
Hợp chất 3	fluxapyroxad	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	folpet	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	fosetyl-nhôm	30:1	12:1	5:1
Hợp chất 3	fuberidazole	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	furalaxyl	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	furametpyr	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	guazatine	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	hexaconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	hymexazol	75:1	25:1	9:1
Hợp chất 3	imazalil	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	imibenconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	iminocadine	15:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	iodocarb	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	ipconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	iprobenfos	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	iprodione	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	iprovalicarb	2:1	1:1	1:3

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	isoprothiolane	45:1	15:1	5:1
Hợp chất 3	isopyrazam	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	isotianil	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	kasugamycin	1:2	1:7	1:24
Hợp chất 3	kresoxim-metyl	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	mancozeb	22:1	7:1	3:1
Hợp chất 3	mandipropamid	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	maneb	22:1	7:1	3:1
Hợp chất 3	mepanipyrim	6:1	2:1	1:1
Hợp chất 3	mepronil	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	meptyldinocap	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	metalaxyl	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	metalaxyl-M	1:1	1:4	1:12
Hợp chất 3	metconazole	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	methasulfocarb	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	metiram	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	metominostrobin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	metrafenone	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	myclobutanil	1:1	1:3	1:8
Hợp chất 3	naftifine	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	neo-asozin (sắt (III) metanarsonat)	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	nuarimol	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	octhilinone	15:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	ofurace	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	orysastrobin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	oxadixyl	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	Axit oxolinic	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	oxpoconazole	1:1	1:2	1:5

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	oxycarboxin	4:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	oxytetracyclin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	pefurazoate	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	penconazole	1:2	1:6	1:15
Hợp chất 3	pencycuron	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	penflufen	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	penthiopyrad	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	phospho axit hoặc muối của chúng	15:1	6:1	2:1
Hợp chất 3	phthalide	15:1	6:1	2:1
Hợp chất 3	picoxystrobin	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	piperalin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	polyoxin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	probenazole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	prochloraz	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	procymidone	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	propamocarb hoặc propamocarbhydroclorua	10:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	propiconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	propineb	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	proquinazid	1:1	1:3	1:12
Hợp chất 3	prothiocarb	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	prothioconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	pyraclostrobin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	pyrametostrobin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	pyraoxystrobin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	pyrazophos	15:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	pyribencarb	4:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	pyributicarb	15:1	4:1	1:1
Hợp chất 3	pyrifenox	3:1	1:1	1:3

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	pyrimethanil	3:1	1:1	1:2
Hợp chất 3	pyriofenone	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	pyroquilon	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	pyrrolnitrin	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	quinconazole	1:1	1:2	1:4
Hợp chất 3	quinomethionate	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	quinoxifen	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	quintozone	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	silthiofam	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	simeconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	spiroxamin	5:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	streptomycin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	sulfur	75:1	25:1	9:1
Hợp chất 3	tebuconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	tebufloquin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	tecloftalam	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	tecnazene	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	terbinafine	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	tetraconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	thiabendazole	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	thiifluzamide	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	thiophanate	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	thiophanate-metyl	11:1	4:1	2:1
Hợp chất 3	thiram	37:1	14:1	5:1
Hợp chất 3	tiadinil	2:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	tolclofos-metyl	37:1	14:1	5:1
Hợp chất 3	tolyfluanid	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	triadimefon	1:1	1:2	1:5

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	triadimenol	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	triarimol	1:2	1:7	1:24
Hợp chất 3	triazoxide	15:1	5:1	2:1
Hợp chất 3	tricyclazole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	tridemorph	7:1	2:1	1:1
Hợp chất 3	trifloxystrobin	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	triflumizole	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	triforine	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	trimorphamide	7:1	2:1	1:2
Hợp chất 3	triticonazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	uniconazole	1:1	1:2	1:5
Hợp chất 3	validamycin	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	valifenalate	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	vinclozolin	15:1	6:1	2:1
Hợp chất 3	zineb	37:1	14:1	5:1
Hợp chất 3	ziram	37:1	14:1	5:1
Hợp chất 3	zoxamide	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-methylpipe-ridin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin	1:1	1:2	1:6
Hợp chất 3	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(metylsulfonyl)amino]butanamit	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(etylsulfonyl)amino]butanamit	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4 <i>H</i> -1-benzopyran-4-on	1:1	1:3	1:12
Hợp chất 3	3-[5-(4-clophenyl)-2,3-đimetyl-3-isoxazolidinyl]-pyridin	3:1	1:1	1:3

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	<i>N'</i> -[4-[[3-[(4-clophenyl)metyl]-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-đimetylphenyl]- <i>N</i> -etyl- <i>N</i> -metylmetanimitamit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	4-flophenyl <i>N</i> -[1-[[[1-(4-xyanophenyl)etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbamát	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	<i>N</i> -[[[(xyclopropylmetoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]metylen]benzenaxetamit	1:2	1:7	1:24
Hợp chất 3	α -[metoxyimino]- <i>N</i> -metyl-2-[[[1-[3-(triflometyl)-phenyl]etoxyl]imino]metyl]benzenaxetamit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	<i>N'</i> -[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]- <i>N</i> -etyl- <i>N</i> -metylmetanimitamit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	<i>N</i> -(4-clo-2-nitrophenyl)- <i>N</i> -etyl-4-metylbenzen-sulfonamit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	2-[[[3-(2,6-điclophenyl)-1-metyl-2-propen-1-yliden]amino]oxy]metyl]- α -(metoxyimino)- <i>N</i> -metylbenzenaxetamit	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	pentyl <i>N</i> -[4-[[[(1-metyl-1 <i>H</i> -tetrazol-5-yl)phenyl-metylen]amino]oxy]metyl]-2-thiazolyl]carbamát	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	pentyl <i>N</i> -[6-[[[(1-metyl-1 <i>H</i> -tetrazol-5-yl)phenyl-metylen]amino]oxy]metyl]-2-pyridinyl]carbamát	3:1	1:1	1:3
Hợp chất 3	2-[(3-bromo-6-quinolinyl)oxy]- <i>N</i> -(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-(metylthio)axetamit	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	2-[(3-etynyl-6-quinolinyl)oxy]- <i>N</i> -[1-(hydroxymetyl)-1-metyl-2-propyn-1-yl]-2-(metylthio)axetamit	2:1	1:1	1:4
Hợp chất 3	<i>N</i> -(1,1-đimetyl-2-butyn-1-yl)-2-[(3-etynyl-6-quinolinyl)oxy]-2-(metylthio)axetamit	2:1	1:1	1:4

(*) Tỷ lệ của Hợp phần (b) so với Hợp phần (a) theo trọng lượng.

Mỗi Bảng từ A2 đến A43 được cấu trúc giống như Bảng A1 nêu trên chỉ khác là thông số ở phía dưới tiêu đề cột “Hợp phần (a)” được thay bằng thông số cột Hợp phần (a) tương ứng được thể hiện sau đây. Do đó, ví dụ, trong Bảng A2 tất cả thông số ở phía dưới tiêu đề cột “Hợp phần (a)” đều nêu “Hợp chất 7”, và dòng đầu tiên ở dưới tiêu đề cột trong Bảng A2 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của Hợp chất 7 với acibenzolar-*S*-methyl. Các Bảng từ A3 đến A43 được cấu trúc tương tự.

Số bảng	Thông số cột hợp phần (a)	Số bảng	Thông số cột hợp phần (a)
A2	Hợp chất 7	A23	Hợp chất 252
A3	Hợp chất 8	A24	Hợp chất 253
A4	Hợp chất 13	A25	Hợp chất 254
A5	Hợp chất 17	A26	Hợp chất 257
A6	Hợp chất 40	A27	Hợp chất 258
A7	Hợp chất 47	A28	Hợp chất 259
A8	Hợp chất 81	A29	Hợp chất 260
A9	Hợp chất 82	A30	Hợp chất 261
A10	Hợp chất 122	A31	Hợp chất 262
A11	Hợp chất 136	A32	Hợp chất 263
A12	Hợp chất 143	A33	Hợp chất 264
A13	Hợp chất 144	A34	Hợp chất 265
A14	Hợp chất 161	A35	Hợp chất 266
A15	Hợp chất 195	A36	Hợp chất 267
A16	Hợp chất 238	A37	Hợp chất 268
A17	Hợp chất 239	A38	Hợp chất 269
A18	Hợp chất 240	A39	Hợp chất 270
A19	Hợp chất 241	A40	Hợp chất 271
A20	Hợp chất 244	A41	Hợp chất 273
A21	Hợp chất 245	A42	Hợp chất 275
A22	Hợp chất 247	A43	Hợp chất 276

Bảng B1 liệt kê các kết hợp cụ thể của hợp chất Hợp phần (b) với hợp chất Hợp phần (a) có tính chất minh họa hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp theo sáng chế. Cột đầu tiên của Bảng B1 liệt kê hợp chất Hợp phần (b) cụ thể (ví dụ, “acibenzolar-*S*-methyl” trong dòng đầu tiên). Các cột thứ hai, thứ ba và thứ tư của Bảng B1 liệt kê khoảng tỷ lệ khối lượng ở mức mà tại đó hợp chất Hợp phần (b) thường được phun cho cây trồng trên cánh đồng so với Hợp phần (a) (ví dụ, “2:1 đến 1:180” của acibenzolar-*S*-methyl so với Hợp phần (a) theo trọng lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng B1 bộc lộ cụ thể rằng kết hợp của acibenzolar-*S*-methyl với Hợp phần (a) thường được phun với tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 2:1 đến 1:180. Các dòng còn lại của Bảng B1 được cấu trúc tương tự. Được quan tâm đặc biệt là chế phẩm chứa hỗn hợp gồm bất kỳ một trong số các hợp chất được liệt kê trong phương án 45 làm Hợp phần (a) với hợp chất được liệt kê trong cột Hợp phần (b) của Bảng B1 theo tỷ lệ khối lượng được bộc lộ trong Bảng B1. Do đó, Bảng B1 bổ sung các tỷ lệ cụ thể được bộc lộ trong các Bảng từ A1 đến A43 bằng khoảng tỷ lệ cho các kết hợp này.

Bảng B1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
acibenzolar- <i>S</i> -methyl	2:1 đến 1:180	1:1 đến 1:60	1:1 đến 1:18
aldimorph	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
ametoctradin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
amisulbrom	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
anilazine	90:1 đến 2:1	30:1 đến 4:1	22:1 đến 4:1
azaconazole	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
azoxystrobin	9:1 đến 1:12	3:1 đến 1:4	3:1 đến 1:3
benalaxyl	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
benalaxyl-M	4:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:8
benodanil	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
benomyl	45:1 đến 1:4	15:1 đến 1:1	11:1 đến 1:1
benthiavalicarb hoặc	2:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:12

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
benthiavalicarb-isopropyl			
bethoxazin	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
binapacryl	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
biphenyl	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
bitertanol	15:1 đến 1:5	5:1 đến 1:2	3:1 đến 1:2
bixafen	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
blasticidin-S	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:4 đến 1:30
boscalid	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
bromuconazole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
bupirimate	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:3 đến 1:30
captafol	90:1 đến 1:4	30:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1
captan	90:1 đến 1:4	30:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1
carbendazim	45:1 đến 1:4	15:1 đến 1:2	11:1 đến 2:1
carboxin	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
carpropamid	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
chloroneb	300:1 đến 2:1	100:1 đến 4:1	100:1 đến 14:1
chlorothalonil	90:1 đến 1:4	30:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1
chlozolate	45:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1	11:1 đến 2:1
clotrimazole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
muối đồng như hỗn hợp Bordeaux (triaxit đồng sulfat), đồng oxyclorea, đồng sulfat và đồng hydroxit	450:1 đến 1:1	150:1 đến 4:1	45:1 đến 5:1
cyazofamid	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
cyflufenamid	1:1 đến 1:90	1:2 đến 1:30	1:2 đến 1:24
cymoxanil	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
cyproconazole	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
cyprodinil	22:1 đến 1:9	7:1 đến 1:3	4:1 đến 1:2

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
dichlofluanid	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
diclocymet	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
diclomezine	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
dicloran	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
diethofencarb	22:1 đến 1:9	7:1 đến 1:3	7:1 đến 1:2
difenoconazole	4:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:12
diflumetorim	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
dimethirimol	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:3 đến 1:30
dimethomorph	9:1 đến 1:6	3:1 đến 1:2	3:1 đến 1:2
dimoxystrobin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
diniconazole	3:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:8
diniconazole M	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:1 đến 1:12
dinocap	7:1 đến 1:9	2:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
dithianon	15:1 đến 1:4	5:1 đến 1:2	5:1 đến 1:2
dodemorph	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
dodine	30:1 đến 1:2	10:1 đến 2:1	10:1 đến 2:1
edifenphos	30:1 đến 1:9	10:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
enestroburin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
epoxiconazole	3:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:7
etaconazole	3:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:7
ethaboxam	7:1 đến 1:9	2:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
ethirimol	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
etridiazole	30:1 đến 1:9	10:1 đến 1:3	7:1 đến 1:2
famoxadone	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
fenamidone	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
fenarimol	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:2 đến 1:24
fenbuconazole	3:1 đến 1:30	1:1 đến 1:10	1:1 đến 1:10
fenfuram	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
fenhexamid	30:1 đến 1:2	10:1 đến 2:1	10:1 đến 2:1
fenoxanil	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 1:1
fenpiclonil	75:1 đến 1:9	25:1 đến 1:3	15:1 đến 2:1
fenpropidin	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
fenpropimorph	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
fenpyrazamin	100:1 đến 1:100	10:1 đến 1:10	3:1 đến 1:3
muối fentin như axetat, clorua hoặc hydroxit	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
ferbam	300:1 đến 1:2	100:1 đến 2:1	30:1 đến 4:1
ferimzone	30:1 đến 1:5	10:1 đến 1:2	7:1 đến 1:2
fluazinam	22:1 đến 1:5	7:1 đến 1:2	3:1 đến 1:2
fludioxonil	7:1 đến 1:12	2:1 đến 1:4	2:1 đến 1:4
flumetover	9:1 đến 1:6	3:1 đến 1:2	3:1 đến 1:2
flumorph	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
fluopicolide	3:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
fluopyram	15:1 đến 1:90	5:1 đến 1:30	3:1 đến 1:3
flomide	150:1 đến 2:1	50:1 đến 4:1	37:1 đến 5:1
fluoxastrobin	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
fluquinconazole	4:1 đến 1:12	1:1 đến 1:4	1:1 đến 1:4
flusilazole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
flusulfamide	90:1 đến 1:2	30:1 đến 2:1	15:1 đến 2:1
flutianil	7:1 đến 1:36	2:1 đến 1:12	1:1 đến 1:6
flutolanil	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
flutriafol	4:1 đến 1:12	1:1 đến 1:4	1:1 đến 1:4
fluxapyroxad	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
folpet	90:1 đến 1:4	30:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1
fosetyl-nhôm	225:1 đến 2:1	75:1 đến 5:1	30:1 đến 5:1
fuberidazole	45:1 đến 1:4	15:1 đến 1:2	11:1 đến 2:1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
furalaxyl	15:1 đến 1:45	5:1 đến 1:15	1:1 đến 1:6
furametpyr	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
guazatine hoặc iminoctadine	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
hexaconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
hymexazol	225:1 đến 2:1	75:1 đến 4:1	75:1 đến 9:1
imazalil	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
imibenconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
iodocarb	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
ipconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
iprobenfos	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
iprodione	120:1 đến 1:2	40:1 đến 2:1	15:1 đến 2:1
iprovalicarb	9:1 đến 1:9	3:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
isoprothiolane	150:1 đến 2:1	50:1 đến 4:1	45:1 đến 5:1
isopyrazam	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
isotianil	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
kasugamycin	7:1 đến 1:90	2:1 đến 1:30	1:2 đến 1:24
kresoxim-metyl	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
mancozeb	180:1 đến 1:3	60:1 đến 2:1	22:1 đến 3:1
mandipropamid	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
maneb	180:1 đến 1:3	60:1 đến 2:1	22:1 đến 3:1
mepanipirim	18:1 đến 1:3	6:1 đến 1:1	6:1 đến 1:1
mepronil	7:1 đến 1:36	2:1 đến 1:12	1:1 đến 1:6
meptyldinocap	7:1 đến 1:9	2:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
metalaxyl	15:1 đến 1:45	5:1 đến 1:15	1:1 đến 1:6
metalaxyl-M	7:1 đến 1:90	2:1 đến 1:30	1:1 đến 1:12
metconazole	3:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
methasulfocarb	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 1:1
metiram	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 1:1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
metominostrobin	9:1 đến 1:12	3:1 đến 1:4	3:1 đến 1:3
metrafenone	6:1 đến 1:12	2:1 đến 1:4	2:1 đến 1:4
myclobutanil	5:1 đến 1:26	1:1 đến 1:9	1:1 đến 1:8
naftifine	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
neo-asozin (sắt (III) metanarsonat)	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
nuarimol	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
octhilinone	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 1:1
ofurace	15:1 đến 1:45	5:1 đến 1:15	1:1 đến 1:6
orysastrobin	9:1 đến 1:12	3:1 đến 1:4	3:1 đến 1:3
oxadixyl	15:1 đến 1:45	5:1 đến 1:15	1:1 đến 1:6
Axit oxolinic	30:1 đến 1:9	10:1 đến 1:3	7:1 đến 1:2
oxpoconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
oxycarboxin	18:1 đến 1:6	6:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
oxytetracyclin	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
pefurazate	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
penconazole	1:1 đến 1:45	1:2 đến 1:15	1:2 đến 1:15
pencycuron	150:1 đến 1:2	50:1 đến 2:1	11:1 đến 2:1
penflufen	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
penthiopyrad	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
Axit phosphor và muối của chúng	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
phthalide	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
picoxystrobin	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
piperalin	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
polyoxin	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
probenazole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
prochloraz	22:1 đến 1:4	7:1 đến 1:1	7:1 đến 1:2
procymidone	45:1 đến 1:3	15:1 đến 1:1	11:1 đến 2:1
propamocarb hoặc propamocarb-	30:1 đến 1:2	10:1 đến 2:1	10:1 đến 2:1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
hydroclorua			
propiconazole	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
propineb	45:1 đến 1:2	15:1 đến 2:1	11:1 đến 2:1
proquinazid	3:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:12
prothiocarb	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
prothioconazole	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
pyraclostrobin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
pyrametostrobin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
pyraoxystrobin	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
pyrazophos	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 1:1
pyribencarb	15:1 đến 1:6	5:1 đến 1:2	4:1 đến 1:2
pyrifenox	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
pyrimethanil	30:1 đến 1:6	10:1 đến 1:2	3:1 đến 1:2
pyriofenone	6:1 đến 1:12	2:1 đến 1:4	2:1 đến 1:4
pyroquilon	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
pyrrolnitrin	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
quinconazole	4:1 đến 1:12	1:1 đến 1:4	1:1 đến 1:4
quinmethionate	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
quinoxifen	4:1 đến 1:18	1:1 đến 1:6	1:1 đến 1:6
quintozene	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
silthiofam	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
simeconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
spiroxamin	22:1 đến 1:4	7:1 đến 1:2	5:1 đến 1:2
streptomycin	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
sulfur	300:1 đến 3:1	100:1 đến 9:1	75:1 đến 9:1
tebuconazole	7:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	1:1 đến 1:5
tebufloquin	100:1 đến 1:100	10:1 đến 1:10	3:1 đến 1:3
tecloftalam	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
tecnazene	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
terbinafine	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
tetraconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
thiabendazole	45:1 đến 1:4	15:1 đến 1:2	11:1 đến 2:1
thifluzamide	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
thiophanate	45:1 đến 1:3	15:1 đến 2:1	11:1 đến 2:1
thiophanate-metyl	45:1 đến 1:3	15:1 đến 2:1	11:1 đến 2:1
thiram	150:1 đến 1:2	50:1 đến 2:1	37:1 đến 5:1
tiadinil	12:1 đến 1:9	4:1 đến 1:3	2:1 đến 1:3
tolclofos-metyl	150:1 đến 1:2	50:1 đến 2:1	37:1 đến 5:1
tolylfluanid	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
triadimefon	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
triadimenol	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
triarimol	3:1 đến 1:90	1:1 đến 1:30	1:2 đến 1:24
triazoxide	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	15:1 đến 2:1
tricyclazole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
tridemorph	30:1 đến 1:3	10:1 đến 1:1	7:1 đến 1:1
trifloxystrobin	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
triflumizole	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
triforine	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
trimorphamide	45:1 đến 1:9	15:1 đến 1:3	7:1 đến 1:2
triticonazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
uniconazole	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:5
validamycin	150:1 đến 1:36	50:1 đến 1:12	3:1 đến 1:3
valifenalate	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
vinclozolin	120:1 đến 1:2	40:1 đến 2:1	15:1 đến 2:1
zineb	150:1 đến 1:2	50:1 đến 2:1	37:1 đến 5:1
ziram	150:1 đến 1:2	50:1 đến 2:1	37:1 đến 5:1

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
zoxamide	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-metylpipeidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin	15:1 đến 1:36	5:1 đến 1:12	1:1 đến 1:6
<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(metylsulfonyl)amino]-butanamit	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxyphe-nyl]etyl]-3-metyl-2-[(etyl-sulfonyl)amino]butanamit	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4 <i>H</i> -1-benzopyran-4-on	3:1 đến 1:36	1:1 đến 1:12	1:1 đến 1:12
3-[5-(4-clophenyl)-2,3-đimetyl-3-isoxazolidinyl]pyridin	15:1 đến 1:9	5:1 đến 1:3	3:1 đến 1:3
<i>N'</i> -[4-[[3-[(4-clophenyl)metyl]-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy]-2,5-đimetylphenyl]- <i>N</i> -etyl- <i>N</i> -metylmetanimitamit	20:1 đến 1:20	8:1 đến 1:8	3:1 đến 1:3
4-flophenyl <i>N</i> -[1-[[[1-(4-xyanophenyl)-etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbamát	6:1 đến 1:18	2:1 đến 1:6	2:1 đến 1:4
<i>N</i> -[(xyclopropylmetoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]-metylen]benzenaxetamit	1:1 đến 1:90	1:2 đến 1:30	1:2 đến 1:24
α -[metoxyimino]- <i>N</i> -metyl-2-[[[1-[3-(triflometyl)phenyl]etoxyl]imino]-metyl]benzenaxetamit	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3

Hợp phần (b)	Tỷ lệ khối lượng thông thường	Tỷ lệ khối lượng thông thường hơn	Tỷ lệ khối lượng thông thường nhất
<i>N</i> -[4-[4-clo-3-(triflometyl)-phenoxy]-2,5-đimetylphenyl]- <i>N</i> -etyl- <i>N</i> -metylmetanimitamit	15:1 đến 1:18	5:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
<i>N</i> -(4-clo-2-nitrophenyl)- <i>N</i> -etyl-4-metylbenzensulfonamit	15:1 đến 1:18	5:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
2-[[[3-(2,6-điclophenyl)-1-metyl-2-propen-1-yliden]amino]oxy]metyl]- α -(metoxyimino)- <i>N</i> -metylbenzenaxetamit	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
pentyl <i>N</i> -[4-[[[(1-metyl-1 <i>H</i> -tetrazol-5-yl)phenylmetylen]-amino]oxy]metyl]-2-thiazolyl]carbamat	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
pentyl <i>N</i> -[6-[[[(1-metyl-1 <i>H</i> -tetrazol-5-yl)phenylmetylen]amino]oxy]metyl]-2-pyridinyl]carbamat	9:1 đến 1:18	3:1 đến 1:6	3:1 đến 1:3
2-[(3-bromo-6-quinolinyloxy)- <i>N</i> -(1,1-đimetyl-2-buty-1-yl)-2-(metylthio)axetamit	5:1 đến 1:22	2:1 đến 1:8	2:1 đến 1:4
2-[(3-ety-6-quinolinyloxy)- <i>N</i> -[1-(hydroxymetyl)-1-metyl-2-propyn-1-yl]-2-(metylthio)axetamit	5:1 đến 1:22	2:1 đến 1:8	2:1 đến 1:4
<i>N</i> -(1,1-đimetyl-2-buty-1-yl)-2-[(3-ety-6-quinolinyloxy)-2-(metylthio)axetamit	5:1 đến 1:22	2:1 đến 1:8	2:1 đến 1:4

Như đã nêu trên, sáng chế bao gồm các phương án trong đó trong các chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b), hợp phần (b) chứa ít nhất một chất trừ nấm từ mỗi trong số hai nhóm được chọn từ (b1) đến (b46). Các Bảng từ C1 đến C43 liệt kê các hỗn hợp cụ thể (số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong Bảng phụ lục A) để minh hoạ các phương án trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một chất trừ nấm từ mỗi trong số hai nhóm được chọn từ (b1) đến (b46). Trong Bảng C1, mỗi dòng ở dưới đề mục của cột “Hợp phần (a)” và “Hợp phần (b)” bộc lộ cụ thể hỗn hợp của Hợp phần (a), là Hợp chất 3, với ít nhất hai chất hợp phần trừ nấm (b). Thông tin phía dưới đề mục “Tỷ lệ minh hoạ” bộc lộ ba tỷ lệ khối lượng cụ thể của Hợp phần (a) so với mỗi chất hợp phần trừ nấm (b) trong trình tự cho hỗn hợp được bộc lộ. Ví dụ, dòng đầu tiên bộc lộ hỗn hợp gồm Hợp chất 3 với cyproconazole và azoxystrobin và liệt kê tỷ lệ khối lượng của Hợp chất 3 so với cyproconazole so với azoxystrobin là 1:1:1, 2:1:1 hoặc 3:1:1.

Bảng C1

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh hoạ(*)
Hợp chất 3	cyproconazole azoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole kresoxim-metyl	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole picoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole pyraclostrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole pyrametrostrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole pyraoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole trifloxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole bixafen	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole boscalid	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole cyflufenamid	1:2:1 2:2:1 3:2:1
Hợp chất 3	cyproconazole fluopyram	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole isopyrazam	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole metrafenone	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole penthiopyrad	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole proquinazid	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole pyriofenone	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole quinoxifen	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole sedaxane	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	cyproconazole picoxystrobin proquinazid	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1
Hợp chất 3	cyproconazole trifloxystrobin proquinazid	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1
Hợp chất 3	difenconazole azoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole kresoxim-metyl	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole picoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole pyraclostrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole pyrametrostrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole pyraoxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole trifloxystrobin	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Hợp chất 3	difenconazole bixafen	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole boscalid	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole cyflufenamid	1:2:1 2:2:1 3:2:1
Hợp chất 3	difenconazole fluopyram	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole isopyrazam	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole metrafenone	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole penthiopyrad	1:1:2 2:1:2 3:1:2
Hợp chất 3	difenconazole proquinazid	1:1:1 2:1:1 3:1:1

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)		Tỷ lệ minh hoạ(*)			
Hợp chất 3	difenconazole	pyriofenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	difenconazole	quinoxifen	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	difenconazole	sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	difenconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	difenconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	kresoxim-metyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	pyrametostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	pyraoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	pyriofenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	quinoxifen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	epoxiconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	epoxiconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	metconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	kresoxim-metyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	pyrametostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	pyraoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	metconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	metconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	metconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Hợp chất 3	metconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)		Tỷ lệ minh họa(*)			
Hợp chất 3	metconazole	isopyrazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	metconazole	metrafenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	metconazole	penthiopyrad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	metconazole	proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	metconazole	pyriofenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	metconazole	quinoxifen	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	metconazole	sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	metconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	metconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	myclobutanil	azoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	kresoxim-metyl	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	picoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	pyraclostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	pyrametostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	pyraoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	trifloxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	bixafen	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	cyflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	fluopyram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	isopyrazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	metrafenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	penthiopyrad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	pyriofenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	quinoxifen	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	myclobutanil	sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Hợp chất 3	myclobutanil	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	myclobutanil	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	prothioconazole	azoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	kresoxim-metyl	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	picoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	pyraclostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	pyrametostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	pyraoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Hợp chất 3	prothioconazole	trifloxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1	

Hợp phần (a)	Hợp phần (b)	Tỷ lệ minh họa(*)		
Hợp chất 3	prothioconazole bixafen	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole cyflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1
Hợp chất 3	prothioconazole fluopyram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole isopyrazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole metrafenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole penthiopyrad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	prothioconazole pyriofenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole quinoxifen	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	prothioconazole sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	prothioconazole picoxystrobin proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	prothioconazole trifloxystrobin proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole azoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole kresoxim-metyl	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole picoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole pyraclostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole pyrametostrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole pyraoxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole trifloxystrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole bixafen	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole cyflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1
Hợp chất 3	tebuconazole fluopyram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole isopyrazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole metrafenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole penthiopyrad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole pyriofenone	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole quinoxifen	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Hợp chất 3	tebuconazole picoxystrobin proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Hợp chất 3	tebuconazole trifloxystrobin proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

(*) Tỷ lệ của Hợp phần (a) so với Hợp phần (b) in trình tự, theo trọng lượng.

Mỗi Bảng từ C2 đến C43 được cấu trúc giống như Bảng C1 nêu trên chỉ khác là các thông số ở dưới đề mục cột “Hợp phần (a)” được thay bằng thông số cột Hợp phần (a) tương ứng được thể hiện sau đây. Do đó, ví dụ, trong Bảng C2 thông tin ở dưới đề mục cột “Hợp phần (a)” tất cả đều nêu “Hợp chất 7”, và dòng đầu tiên ở dưới đề mục của cột trong Bảng C2 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của Hợp chất 7 với cyproconazole và azoxystrobin, và với các tỷ lệ khối lượng minh họa 1:1:1, 2:1:1 và 3:1:1 của Hợp chất 7:cyproconazole:azoxystrobin. Các Bảng từ C3 đến C43 được cấu trúc tương tự.

Số bảng	Thông số cột hợp phần (a)	Số bảng	Thông số cột hợp phần (a)
C2	Hợp chất 7	C23	Hợp chất 252
C3	Hợp chất 8	C24	Hợp chất 253
C4	Hợp chất 13	C25	Hợp chất 254
C5	Hợp chất 17	C26	Hợp chất 257
C6	Hợp chất 40	C27	Hợp chất 258
C7	Hợp chất 47	C28	Hợp chất 259
C8	Hợp chất 81	C29	Hợp chất 260
C9	Hợp chất 82	C30	Hợp chất 261
C10	Hợp chất 122	C31	Hợp chất 262
C11	Hợp chất 136	C32	Hợp chất 263
C12	Hợp chất 143	C33	Hợp chất 264
C13	Hợp chất 144	C34	Hợp chất 265
C14	Hợp chất 161	C35	Hợp chất 266
C15	Hợp chất 195	C36	Hợp chất 267
C16	Hợp chất 238	C37	Hợp chất 268
C17	Hợp chất 239	C38	Hợp chất 269
C18	Hợp chất 240	C39	Hợp chất 270
C19	Hợp chất 241	C40	Hợp chất 271
C20	Hợp chất 244	C41	Hợp chất 273
C21	Hợp chất 245	C42	Hợp chất 275

C22

Hợp chất 247

C43

Hợp chất 276

Đáng lưu ý là chế phẩm theo sáng chế chứa hợp chất có công thức 1 (hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng) với ít nhất một hợp chất diệt nấm khác có vị trí tác động khác với hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, việc kết hợp với ít nhất một hợp chất diệt nấm khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng có vị trí tác động khác sẽ được ưu tiên đặc biệt cho việc quản lý tính kháng thuốc. Do đó, tốt hơn nếu chế phẩm theo sáng chế có thể chứa ít nhất một hoạt chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm (b1) đến (b46) như đã nêu trên, có phổ phòng trừ tương tự nhưng có vị trí tác động khác.

Chế phẩm chứa hợp phần (a), hoặc hợp phần (a) với hợp phần (b), có thể được trộn tiếp với một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác bao gồm các thuốc trừ sâu, các thuốc diệt giun tròn, các chất diệt vi khuẩn, các thuốc diệt ve bét, các thuốc diệt cỏ, các chất an toàn cho thuốc diệt cỏ, các chất điều hoà sự phát triển chẳng hạn như các chất ức chế sự lột xác côn trùng và các chất kích thích rễ, chất triệt sản, hóa chất giao tiếp của côn trùng, chất xua đuổi, các chất dẫn dụ, các pheromon, các chất kích thích ăn, các chất dinh dưỡng cho thực vật, các chất có hoạt tính sinh học khác hoặc vi khuẩn, virus hoặc nấm ăn sinh vật gây bệnh để tạo ra thuốc trừ dịch hại gồm nhiều hợp phần có phổ bảo vệ nông nghiệp thậm chí là rộng hơn. Do đó, sáng chế còn đề cập đến chế phẩm chứa một lượng hữu hiệu diệt nấm của hợp phần (a), hoặc hỗn hợp của hợp phần (a) với hợp phần (b), và lượng có hoạt tính sinh học hữu hiệu của ít nhất một chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung và có thể còn chứa ít nhất một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn hoặc chất pha loãng dạng lỏng. Ngoài ra, hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác cũng có thể được chế hóa riêng rẽ thành chế phẩm chứa ít nhất một chất hoạt động bề mặt, chất rắn hoặc chất pha loãng dạng lỏng. Đối với chế phẩm theo sáng chế, một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể được chế hóa cùng với một hoặc cả hai hợp phần (a) và (b) để tạo ra hỗn hợp sơ bộ, hoặc một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể được chế hóa riêng rẽ với hợp phần (a)

và (b) và các chế phẩm này được kết hợp với nhau trước khi dùng (ví dụ, trong thùng phun xịt) hoặc, theo cách khác, được dùng liên tiếp.

Ví dụ về hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học như vậy mà chế phẩm chứa hợp phần (a), hoặc hợp phần (a) với hợp phần (b), có thể được chế hóa cùng là: các thuốc trừ sâu chẳng hạn như abamectin, acephate, axetamiprit, acetoprole, acrinathrin, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, buprofezin, carbofuran, cartap, chinomethionat, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorantraniliprole, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chlorobenzilate, chromafenozide, clothianidin, cyantraniliprole, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gama-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyhexatin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienochlor, diflubenzuron, dimefluthrin, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etoxazole, fenamiphos, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenpyroximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenerim, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imicyafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyt, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, metofluthrin, milbemycin oxim, monocrotophos, nicotin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, prothiocarb, protrifenbute, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxifen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflo, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron; các thuốc diệt giun tròn chẳng hạn như aldicarb, imicyafos, oxamyl và fenamiphos; các chất diệt vi khuẩn chẳng hạn như streptomycin; các thuốc diệt ve bét chẳng hạn như

amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyenopyrafen, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben và tebufenpyrad; và các tác nhân sinh học bao gồm vi khuẩn ăn sinh vật gây bệnh, chẳng hạn như *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, và các nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, Cellcap, MPV, MPVII); nấm ăn sinh vật gây bệnh, chẳng hạn như nấm Green muscardine; và virus ăn sinh vật gây bệnh bao gồm baculovirus, nucleopolyhedro virus (NPV) chẳng hạn như HzNPV, AfNPV; và virus có bề mặt dạng hạt (GV) chẳng hạn như CpGV.

Các tài liệu tham khảo chung cho các chất bảo vệ dùng trong nông nghiệp này (tức là các thuốc trừ sâu, các thuốc diệt nấm, các thuốc diệt giun tròn, các thuốc diệt ve bét, các thuốc diệt cỏ và tác nhân sinh học) bao gồm *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 và *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Đối với các phương án trong đó một hoặc nhiều các thành phần trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ khối lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) so với hợp phần (a), hoặc hỗn hợp của hợp phần (a) với hợp phần (b), thông thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Đáng lưu ý là các tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:100 đến 3000:1, hoặc nằm trong khoảng từ 1:30 đến 300:1 (ví dụ như các tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:1 đến 30:1). Sẽ chứng tỏ được rằng việc đưa thêm hợp phần bổ sung này có thể mở rộng phổ các bệnh được phòng trừ nằm ngoài phổ được phòng trừ bởi hợp phần (a), hoặc hỗn hợp của hợp phần (a) với hợp phần (b).

Hợp chất hợp phần (a) và/hoặc kết hợp của chúng với hợp chất hợp phần (b) và/hoặc một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể áp dụng cho thực vật được biến nạp di truyền để biểu hiện protein gây độc cho loài gây hại không xương sống (chẳng hạn như các nội độc tố delta của *Bacillus thuringiensis*). Tác động của hợp phần (a) theo sáng chế được dùng ngoại sinh đơn lẻ hoặc kết hợp với hợp phần (b) có thể có tác dụng hiệp đồng với protein độc tố được biểu hiện.

Đáng lưu ý là kết hợp hoặc chế phẩm chứa hợp phần (a), hoặc hợp phần (a) và (b), như được mô tả trong Bản chất kỹ thuật của sáng chế còn chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống (ví dụ, thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve). Được ưu tiên là chế phẩm chứa hợp phần (a) và ít nhất một (tức là một hoặc nhiều) hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống, mà sau đó có thể được kết hợp với hợp phần (b) để tạo ra a chế phẩm chứa hợp phần (a) và (b) và một hoặc nhiều hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống. Theo cách khác, không cần phải trộn trước hết với hợp phần (b), một lượng có hoạt tính sinh học của chế phẩm chứa hợp phần (a) với ít nhất tác nhân một phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể được phun lên thực vật hoặc hạt giống thực vật (trực tiếp hoặc thông qua môi trường của thực vật hoặc hạt giống thực vật) để bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nguồn bệnh là nấm gây ra và thương tổn do loài gây hại không xương sống gây ra.

Đối với các phương án trong đó một hoặc nhiều hợp chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được sử dụng, tỷ lệ khối lượng của các hợp chất này (tổng số) so với các hợp chất hợp phần (a) thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Được ưu tiên là tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ như tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng thông qua thử nghiệm đơn giản một lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hoạt chất cần thiết cho phổ hoạt tính sinh học mong muốn.

Được ưu tiên là chế phẩm theo sáng chế mà chứa ngoài hợp chất hợp phần (a), đơn lẻ hoặc kết hợp với hợp phần trừ nấm (b), ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm gồm abamectin, acephate, Acetamiprid, acetoprole, acrinathrin, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, buprofezin, carbofuran, cartap, chinomethionat, chlorfenapyr, chlorfluaazuron, chlorantraniliprole, clorpyrifos, clorpyrifos-metyl, chlorobenzilate, chromafenozid, clothianidin, cyantraniliprole, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin,

gama-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyhexatin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienochlor, diflubenzuron, dimefluthrin, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etoxazole, fenamiphos, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenpyroximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenerim, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imicyafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyt, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, metofluthrin, milbemycin oxime, monocrotophos, nicotin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxifen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethylfluthin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, virut nucleopolyhedro, nội độc tố delta bao nang của *Bacillus thuringiensis*, baculovirut, vi khuẩn gây bệnh cho côn trùng, virut gây bệnh cho côn trùng và nấm gây bệnh cho côn trùng. Điều đáng lưu ý là danh sách nêu trên không có meperflutrin, sulfoxaflor và tetramethylfluthrin.

Trong một số trường hợp, các kết hợp của hợp chất hợp phần (a), ở dạng đơn lẻ hoặc trong hỗn hợp với hợp phần trừ nấm (b), với các hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học (đặc biệt phòng trừ loài gây hại không xương sống) (tức là hoạt chất) có thể có tác dụng lớn hơn cộng hợp (tức là tác dụng hiệp đồng). Việc giảm lượng hoạt chất giải phóng vào môi trường đồng thời vẫn đảm bảo tác dụng phòng trừ sinh vật gây hại hiệu quả luôn là điều mong muốn. Khi tác dụng hiệp đồng của hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống xảy ra ở tỷ lệ dùng đồng thời cho mức

độ phòng trừ loài gây hại không xương sống thỏa mãn về mặt nông học, thì các kết hợp như vậy có thể là có lợi để làm giảm chi phí sản xuất cây trồng và giảm lượng nạp vào môi trường.

Bảng D1 liệt kê các kết hợp cụ thể của tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống với Hợp chất 3 (được nhận diện trong Bảng phụ lục A) như là hợp phần (a) hợp chất có tính chất minh họa của các hỗn hợp và chế phẩm chứa các thành phần hoạt tính và các phương pháp sử dụng chúng theo sáng chế. Cột thứ hai của Bảng D1 liệt kê các tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống cụ thể (ví dụ, “Abamectin” trong dòng đầu tiên). Cột thứ ba của Bảng D1 liệt kê cơ chế tác động (nếu đã biết) hoặc nhóm hóa chất của tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống. Cột thứ tư của Bảng D1 liệt kê các phương án về khoảng tỷ lệ khối lượng về mức mà tại đó tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống thường được dùng so với Hợp chất 3 đơn lẻ hoặc kết hợp với hợp phần trừ nấm (b) (ví dụ, tỷ lệ “50:1 đến 1:50” abamectin so với Hợp chất 3 theo trọng lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng D1 bộc lộ cụ thể kết hợp của Hợp chất 3 với abamectin mà thường được phun với tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của Bảng D1 được cấu trúc tương tự.

Bảng D1

Hợp phần (a)	Tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống	Cơ chế tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Hợp chất 3	Abamectin	lacton mạch vòng lớn	50:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Acetamiprid	Neonicotinoid	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Amitraz	các phối tử thụ thể octopamin	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Avermectin	lacton mạch vòng lớn	50:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Azadirachtin	chất chủ vận ecdysone	100:1 đến 1:120
Hợp chất 3	Beta-cyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Bifenthrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Hợp chất 3	Buprofezin	chất ức chế tổng hợp chitin	500:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Cartap	chất tương tự nereistoxin	100:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Chlorantraniliprole	các phối tử thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Hợp chất 3	Chlorfenapyr	chất ức chế chuyển vận electron ty thể	300:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Clorpyrifos	chất ức chế cholinesteraza	500:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Clothianidin	Neonicotinoid	100:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Cyantraniliprole	các phối tử thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Hợp chất 3	Cyfluthrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Cyhalothrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Cypermethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Cyromazine	chất ức chế tổng hợp chitin	400:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Deltamethrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Dieldrin	các chất trừ sâu xyclođien	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Dinotefuran	Neonicotinoid	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Diofenolan	chất ức chế lột xác	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Emamectin	lacton mạch vòng lớn	50:1 đến 1:10
Hợp chất 3	Endosulfan	các chất trừ sâu xyclođien	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Esfenvalerate	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Ethiprole	Chất phong bế kênh clorua được điều hòa bởi GABA	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Fenothiocarb		150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Fenoxycarb	chất đẳng hiệu hormon ấu trùng	500:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Fenvalerate	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200

Hợp phần (a)	Tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống	Cơ chế tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Hợp chất 3	Fipronil	Chất phong bế kênh clorua được điều hòa bởi GABA	150:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Flonicamid		200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Flubendiamide	các phối tử thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Hợp chất 3	Flufenoxuron	chất ức chế tổng hợp chitin	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Hexaflumuron	chất ức chế tổng hợp chitin	300:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Hydramethylnon	chất ức chế chuyển vận electron ty thể	150:1 đến 1:250
Hợp chất 3	Imidacloprid	Neonicotinoid	1000:1 đến 1:1000
Hợp chất 3	Indoxacarb	chất điều biến kênh natri	200:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Lambda-cyhalothrin	chất điều biến kênh natri	50:1 đến 1:250
Hợp chất 3	Lufenuron	chất ức chế tổng hợp chitin	500:1 đến 1:250
Hợp chất 3	Meperfluthrin	Chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Metaflumizone		200:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Methomyl	chất ức chế cholinesteraza	500:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Methoprene	chất đẳng hiệu hormon ấu trùng	500:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Methoxyfenozide	chất chủ vận ecdysone	50:1 đến 1:50
Hợp chất 3	Nitenpyram	Neonicotinoid	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Nithiazine	Neonicotinoid	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Novaluron	chất ức chế tổng hợp chitin	500:1 đến 1:150
Hợp chất 3	Oxamyl	chất ức chế cholinesteraza	200:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Pymetrozine		200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Pyrethrin	chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:10
Hợp chất 3	Pyridaben	chất ức chế chuyển vận electron ty thể	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Pyridalyl		200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Pyriproxyfen	chất đẳng hiệu hormon ấu trùng	500:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Ryanodine	các phối tử thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Hợp chất 3	Spinetoram	lacton mạch vòng lớn	150:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Spinosad	lacton mạch vòng lớn	500:1 đến 1:10
Hợp chất 3	Spirodiclofen	chất ức chế sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Spiromesifen	chất ức chế sinh tổng hợp lipid	200:1 đến 1:200

Hợp phần (a)	Tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống	Cơ chế tác động hoặc nhóm hóa chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Hợp chất 3	Sulfoxaflor		200 : 1 đến 1: 200
Hợp chất 3	Tebufenozide	chất chủ vận ecdysone	500:1 đến 1:250
Hợp chất 3	Tetramethylfluthrin	Chất điều biến kênh natri	100:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Thiacloprid	Neonicotinoid	100:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Thiamethoxam	neonicotinoid	1250:1 đến 1:1000
Hợp chất 3	Thiodicarb	chất ức chế cholinsteraza	500:1 đến 1:400
Hợp chất 3	Thiosultap-natri		150:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Tralomethrin	chất điều biến kênh natri	150:1 đến 1:200
Hợp chất 3	Triazamate	chất ức chế cholinsteraza	250:1 đến 1:100
Hợp chất 3	Triflumuron	chất ức chế tổng hợp chitin	200:1 đến 1:100
Hợp chất 3	<i>Bacillus thuringiensis</i>	các tác nhân sinh học	50:1 đến 1:10
Hợp chất 3	nội độc tố delta của <i>Bacillus thuringiensis</i>	các tác nhân sinh học	50:1 đến 1:10
Hợp chất 3	NPV (ví dụ, Gemstar)	các tác nhân sinh học	50:1 đến 1:10

Mỗi Bảng từ D2 đến D54 đều được cấu trúc giống như Bảng D1 nêu trên chỉ khác là các thông số ở dưới đề mục cột “Hợp phần (a)” được thay bằng thông số cột Hợp phần (a) tương ứng được thể hiện sau đây. Do đó, ví dụ, trong Bảng D2 thông tin ở dưới đề mục cột “Hợp phần (a)” tất cả đều nêu “Hợp chất 18”, và dòng đầu tiên ở dưới đề mục của cột trong Bảng D2 bộc lộ cụ thể hỗn hợp của Hợp chất 18 và abamectin. Các Bảng từ D3 đến D54 được cấu trúc tương tự.

Số bảng	Danh sách cột hợp phần (a)	Số bảng	Danh sách cột hợp phần (a)
D2	Hợp chất 7	D23	Hợp chất 252
D3	Hợp chất 8	D24	Hợp chất 253
D4	Hợp chất 13	D25	Hợp chất 254
D5	Hợp chất 17	D26	Hợp chất 257
D6	Hợp chất 40	D27	Hợp chất 258
D7	Hợp chất 47	D28	Hợp chất 259
D8	Hợp chất 81	D29	Hợp chất 260
D9	Hợp chất 82	D30	Hợp chất 261
D10	Hợp chất 122	D31	Hợp chất 262
D11	Hợp chất 136	D32	Hợp chất 263
D12	Hợp chất 143	D33	Hợp chất 264
D13	Hợp chất 144	D34	Hợp chất 265
D14	Hợp chất 161	D35	Hợp chất 266
D15	Hợp chất 195	D36	Hợp chất 267
D16	Hợp chất 238	D37	Hợp chất 268
D17	Hợp chất 239	D38	Hợp chất 269
D18	Hợp chất 240	D39	Hợp chất 270
D19	Hợp chất 241	D40	Hợp chất 271
D20	Hợp chất 244	D41	Hợp chất 273
D21	Hợp chất 245	D42	Hợp chất 275
D22	Hợp chất 247	D43	Hợp chất 276

Một phương án của tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống (ví dụ, các chất trừ sâu và các thuốc diệt ve bét) để trộn với các hợp chất hợp phần (a) bao gồm chất điều biến kênh natri chẳng hạn như bifenthrin, cypermethrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerate, fenvalerate, indoxacarb, meperfluthrin, metofluthrin, profluthrin, pyrethrin, tetramethylfluthrin và tralomethrin; chất ức chế cholinesteraza chẳng hạn như clorpyrifos, methomyl, oxamyl, thiodicarb và triazamate; các neonicotinoid chẳng hạn như acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine,

thiacloprid và thiamethoxam; lacton mạch vòng lớn có hoạt tính trừ sâu chẳng hạn như spinetoram, spinosad, abamectin, avermectin và emamectin; các chất phong bế kênh clorua được điều hòa bằng GABA (axit γ -aminobutyric) chẳng hạn như endosulfan, ethiprole và fipronil; chất ức chế tổng hợp chitin chẳng hạn như buprofezin, cyromazine, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron; chất đẳng hiệu hormon ấu trùng chẳng hạn như diofenolan, fenoxycarb, methoprene và pyriproxyfen; các phối tử thụ thể octopamin chẳng hạn như amitraz; chất chủ vận ecdysone chẳng hạn như azadirachtin, methoxyfenozide và tebufenozide; các phối tử thụ thể ryanodine chẳng hạn như ryanodine, diazinat antranilic chẳng hạn như chlorantraniliprole, cyantraniliprole và flubendiamide; chất tương tự nereistoxin chẳng hạn như cartap; chất ức chế chuyển vận electron ty thể chẳng hạn như chlorfenapyr, hydramethylnon và pyridaben; chất ức chế sinh tổng hợp lipid chẳng hạn như spirotetramat và spiromesifen; các chất trừ sâu xyclodien chẳng hạn như dieldrin; cyflumetofen; fenothiocarb; flonicamid; metaflumizone; pyrafluprole; pyridalyl; pyriprole; pymetrozine; spirotetramat; và thiosultap-natri. Một phương án của các tác nhân sinh học để trộn với các hợp chất hợp phần (a) bao gồm virus nucleopolyhedro chẳng hạn như HZNPV và AfNPV; *Bacillus thuringiensis* và bao nang nội độc tố delta của *Bacillus thuringiensis* chẳng hạn như Cellcap, MPV và MPVII; cũng như các chất trừ sâu virus có trong tự nhiên và cải biến di truyền bao gồm các thành viên của họ Baculoviridae cũng như nấm ăn côn trùng. Được ưu tiên là chế phẩm chứa hợp phần (a) và ít nhất một hoạt chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ Tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống được nêu ra trong Bảng D1 nêu trên.

Các chế phẩm theo sáng chế là hữu ích làm tác nhân phòng trừ bệnh thực vật. Do đó, sáng chế còn đề cập đến phương pháp phòng trừ các bệnh cho thực vật do các nấm gây bệnh cho thực vật gây ra bao gồm việc đưa lên thực vật hoặc bộ phận của nó cần được bảo vệ, hoặc lên hạt giống thực vật hoặc bộ phận nhân giống sinh dưỡng cần được bảo vệ, một lượng hữu hiệu của chế phẩm theo sáng chế (ví dụ, chế phẩm chứa hợp phần (a), hoặc hợp phần (a) và (b)). Ngoài ra, khía cạnh này của sáng chế cũng có

thể được mô tả là phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa một lượng hữu hiệu diệt nấm của chế phẩm theo sáng chế lên thực vật (hoặc bộ phận của nó) hoặc hạt giống thực vật (trực tiếp hoặc thông qua môi trường (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của thực vật hoặc hạt giống thực vật).

Việc phòng trừ bệnh cho thực thường được thực hiện bằng việc đưa một lượng hữu hiệu của chế phẩm theo sáng chế (ví dụ, chứa hợp phần (a), hoặc hỗn hợp của hợp phần (a) và (b)), thông thường dưới dạng chế phẩm được chế hóa, hoặc trước hoặc sau khi bị nhiễm, vào phần thực vật cần được bảo vệ chẳng hạn như rễ, thân, lá, quả, hạt giống, thân củ hoặc củ, hoặc vào môi trường (đất trồng hoặc cát) thực vật cần được bảo vệ đang phát triển trong đó. Ngoài ra, hợp phần (a) hoặc các hỗn hợp của chúng cũng có thể được đưa lên hạt giống để bảo vệ hạt và cây con phát triển từ hạt. Ngoài ra cũng có thể đưa hỗn hợp này lên qua nước tưới để điều trị thực vật.

Tỷ lệ dùng thích hợp (ví dụ, một lượng hữu hiệu diệt nấm) của hợp phần (a) (tức là ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, *N*-oxit và muối của chúng) cũng như mức dùng thích hợp (ví dụ, lượng có hoạt tính sinh học hữu hiệu, một lượng hữu hiệu diệt nấm hoặc lượng hữu hiệu trừ côn trùng) cho các hỗn hợp và chế phẩm chứa hợp phần (a) theo sáng chế có thể bị ảnh hưởng bởi nhiều yếu tố môi trường và phải được xác định dựa trên điều kiện sử dụng thực tế. Thông thường, có thể bảo vệ lá khi được xử lý với mức hoạt chất từ ít hơn khoảng 1 g/ha đến 5000 g/ha. Hạt giống và cây con thường có thể được bảo vệ khi hạt giống được xử lý với mức nằm trong khoảng từ 0,1 đến khoảng 10 g cho một kilogam hạt giống; và bộ phận nhân giống sinh dưỡng (ví dụ, cành giâm và thân củ) thường được bảo vệ khi bộ phận nhân giống được xử lý với mức nằm trong khoảng từ 0,1 đến khoảng 10 g cho một kilogam bộ phận nhân giống. Thông qua thử nghiệm đơn giản, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng mức dùng hợp phần (a), và các hỗn hợp và chế phẩm của chúng, chứa các kết hợp cụ thể của hoạt chất theo sáng chế cần thiết để tạo ra phổ bảo vệ thực vật và phòng trừ các bệnh cho thực vật mong muốn và tùy ý loài gây hại cho thực vật khác.

Hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, và muối của chúng, là đặc biệt hiệu quả trong việc phòng trừ các bệnh cho thực vật do nấm gây bệnh gây ra, đặc biệt các loài thuộc nhóm Basidiomycete và Ascomycete. Việc kết hợp các hợp chất này với các hợp chất diệt nấm khác có thể tạo ra tác dụng phòng trừ các bệnh gây ra do phổ rộng các nấm gây bệnh cho thực vật ở các nhóm Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete và Deuteromycete. Theo đó, các hỗn hợp và chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này có thể phòng trừ phổ rộng các bệnh cho thực vật, các sinh vật gây bệnh cho cây trồng ở lá bao gồm: các cây hạt ngũ cốc chẳng hạn như cây lúa mì, lúa mạch, cây yến mạch, cây lúa mạch đen, cây triticale (là cây ngũ cốc lai giữa lúa mì và lúa mạch đen), cây lúa, ngô, cây lúa miến và cây kê; cây nho chẳng hạn như cây nho cho quả làm rượu và rượu vang; các cây trồng nông nghiệp chẳng hạn như cây cải dầu (canola), cây hướng dương; cây củ cải đường, đường mía, cây đậu nành, cây lạc (groundnut), cây thuốc lá, cây cỏ linh lăng, cỏ ba lá, cây hồ chì, cây thảo có ba lá trên mỗi cuống (trefoil) và đậu tằm; cây ăn quả thuộc họ táo chẳng hạn như táo, lê, quả táo tây dại, cây sơn trà Nhật bản, cây táo gai tháng Năm (mayhaw) và cây mộc qua; quả có hạt chẳng hạn như quả đào, quả anh đào, quả mận, quả mơ, quả xuân đào và quả hạnh; quả họ cam quýt chẳng hạn như quả chanh, chanh lá cam, quả cam, quả nho, quả quýt (quả quýt tangerine) và quả quýt vàng; các cây rau cho rễ và thân củ và các cây trồng nông nghiệp (và lá của chúng) chẳng hạn như cây atisô, cây trồng trong vườn và cây củ cải đường, cà rốt, cây sắn, cây gừng, cây nhân sâm, cây cải ngựa, cây củ cải vàng, cây khoai tây, cây củ cải, cây củ cải Thụy điển, khoai lang, cây củ cải và cây khoai mỡ; các loại rau thuộc họ hành chẳng hạn như tỏi, tỏi tây, hành và cây hẹ tây; các loài rau lấy lá chẳng hạn như rau arugula (cây cải lông), cần tây, cần tây, cải xoong, rau diếp quăn (rau diếp mạ), cây thì là, rau diếp cải và rau diếp lá, cây mùi tây, cây cải radicchio (rau diếp xoắn), cây đại hoàng, rau bina và cây cải cầu vồng; rau có lá thuộc họ cải bắp (cải dầu) chẳng hạn như cây bông cải xanh, bông cải xanh raab (cây rapini), cải bruxen, cải bắp, cây cải thìa, súp lơ, cây cải lá, cải xoắn, su hào, cây mù tạc và cây củ; các loại rau thuộc họ đậu (cây mọc nước hoặc làm khô) chẳng hạn như đậu lupin, đậu (*Phaseolus* spp.) (bao gồm đậu ván, đậu tây, đậu lima, đậu trắng hay đậu hải quân, đậu Ấn độ, cây đậu tây, đậu cô-ve, đậu tepary và cây đậu sáo), đậu (*Vigna* spp.) (bao gồm đậu adzuki, đậu

đũa, đậu mắt đen, đậu trắng, đậu đũa, cây đậu đũa, đậu crowder, cây đậu ngải, cây đậu xanh, đậu gạo, đậu đũa, đậu đen và đậu đũa yardlong bean), đậu tằm (fava), đậu xanh chickpea (đậu garbanzo), cây guar, cây đậu nhiệt đới Mỹ, đậu lablab, cây đậu lăng và cây đậu Hà lan (*Pisum* spp.) (bao gồm cây đậu dwarf pea, đậu Hà lan có vỏ mềm, cây đậu English pea, đậu Hà lan, đậu Hà lan garden pea, đậu xanh, đậu Hà lan snowpea, đậu Hà lan sugar snap pea, cây đậu Săng và đậu nành); các loại rau cho quả chẳng hạn như cây cà, cây anh đào có nốt sần (*Physalis* spp.), dưa lê và hạt tiêu (bao gồm ớt chuông, ớt cay, hạt tiêu, ớt tiêu Gia-mai-ca, ớt ngọt; cây tomatillo và cà chua); các loại rau bầu bí chẳng hạn như quả su su (quả), bí ngô (bí ngô còn có tên là Chinese preserving melon), loài dưa hấu gốc, dưa chuột, dưa chuột ri, cây bầu ăn được (bao gồm cây bầu hyotan, cây bầu cucuzza, mướp hechima, và bí Chinese okra), *Momordica* spp. (bao gồm cây mướp đắng, dây gấc, khổ qua và dưa leo), dưa lê (bao gồm dưa đỏ và quả bí ngô), bí mùa hạ và bí mùa đông (bao gồm bí đỏ hình quả lê, bí ngô calabaza, bí hubbard, bí đậu, bí sợi) và dưa hấu; các loại cây quả mọng chẳng hạn như quả mâm xôi (bao gồm quả bingleberry, quả boysenberry, quả mâm xôi dewberry, quả mâm xôi lowberry, quả marionberry, quả mâm xôi olallieberry và quả mâm xôi youngberry), cây việt quất, cây nam việt quất, cây lý chua, quả cây cơm cháy, cây lý gai, cây việt quất huckleberry, cây mâm xôi loganberry, cây mâm xôi đỏ raspberry và cây dâu tây; các loại cây cho hạt chẳng hạn như cây quả hạnh, cây beech nut, cây hạt nhân Brazil nut, cây butternut, cây đào lộn hột, cây hạt dẻ, cây dẻ gai, cây phỉ (cây hạt phỉ), cây hạt quả hồ đào, cây macadamia nut, cây hồ đào pécan và cây óc chó; cây quả vùng nhiệt đới và các loại cây trồng khác chẳng hạn như cây chuối, cây chuối lá, cây xoài, cây dừa, cây đu đủ, cây ổi, cây lê tàu, cây vải, cây thùa, cây cà phê, cacao, đường mía, cây cọ dầu, cây vừng, cây cao su và các loại cây gia vị; các cây trồng cho xơ chẳng hạn như cây bông, lanh và cây gai dầu; các loại cỏ (bao gồm các loại cỏ mùa ẩm và mùa lạnh) chẳng hạn như cỏ bent grass, cỏ Kentucky bluegrass, cỏ St. Augustine, cỏ đuôi trâu và cỏ gà.

Các sinh vật gây bệnh bao gồm: Oomycetes, bao gồm các sinh vật gây bệnh *Phytophthora* chẳng hạn như *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*,

Phytophthora parasitica, *Phytophthora cinnamomi* và *Phytophthora capsici*, các sinh vật gây bệnh *Pythium* chẳng hạn như *Pythium aphanidermatum*, và các sinh vật gây bệnh thuộc họ Peronosporaceae chẳng hạn như *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (bao gồm *Peronospora tabacina* và *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (bao gồm *Pseudoperonospora cubensis*) và *Bremia lactucae*; các Ascomycete, bao gồm các sinh vật gây bệnh *Alternaria* chẳng hạn như *Alternaria solani* và *Alternaria brassicae*, các sinh vật gây bệnh *Guignardia* chẳng hạn như *Guignardia bidwelli*, các sinh vật gây bệnh *Venturia* chẳng hạn như *Venturia inaequalis*, các sinh vật gây bệnh *Septoria* chẳng hạn như *Septoria nodorum* và *Septoria tritici*, các sinh vật gây bệnh phấn trắng chẳng hạn như *Blumeria* spp. (bao gồm *Blumeria graminis*) và *Erysiphe* spp. (bao gồm *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea* và *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, các sinh vật gây bệnh *Botrytis* chẳng hạn như *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, các sinh vật gây bệnh *Sclerotinia* chẳng hạn như *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, các sinh vật gây bệnh *Helminthosporium* chẳng hạn như *Helminthosporium tritici repens*, *Pyrenophora teres*, các sinh vật gây bệnh loét cây chẳng hạn như *Glomerella* hoặc *Colletotrichum* spp. (chẳng hạn như *Colletotrichum graminicola* và *Colletotrichum orbiculare*), và *Gaeumannomyces graminis*; các Basidiomycetes, bao gồm bệnh gỉ sắt gây ra do *Puccinia* spp. (chẳng hạn như *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* và *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* và *Phakopsora pachyrhizi*; các sinh vật gây bệnh khác bao gồm *Rhizoctonia* spp. (chẳng hạn như *Rhizoctonia solani* và *Rhizoctonia oryzae*); các sinh vật gây bệnh *Fusarium* chẳng hạn như *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* và *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* và *Cercospora beticola*; *Rutstroemia floccosum* (còn được biết đến là *Sclerotinia homoeocarpa*); và các giống và loài khác gần với các sinh vật gây bệnh này. Thông thường, các sinh vật gây bệnh được gọi là các bệnh, và do đó trong câu trên cụm từ “sinh vật gây bệnh” còn dùng để chỉ bệnh thực vật gây ra do sinh vật gây bệnh này. Cụ thể hơn, các bệnh cho thực vật gây ra do sinh vật gây bệnh. Do đó, ví dụ, bệnh phấn trắng là bệnh ở thực vật do các

sinh vật gây bệnh phần trắng gây ra, các bệnh *Septoria* là bệnh ở thực vật do các sinh vật gây bệnh *Septoria* gây ra, và bệnh gỉ sắt là bệnh ở thực vật do các sinh vật gây bệnh gỉ sắt gây ra. Một số hợp chất diệt nấm cũng có tính chất diệt vi khuẩn, và do đó ngoài hoạt tính diệt nấm, chế phẩm hoặc kết hợp còn có thể có hoạt tính đối với vi khuẩn chẳng hạn như *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae*, và các loài tương tự.

Đáng lưu ý là đã phát hiện được rằng các hợp chất có công thức 1 anilino-pyrazol được thế ở vị trí 2,6 (tức là Công thức 1 trong đó X là NH, và R¹ và R³ không phải là H) trong đó R² là H có đặc tính dược động học được cải thiện đáng kể so với các hợp chất tương ứng trong đó R² không phải là H. Đặc biệt là ở động vật có xương sống động vật, đã nhận thấy rằng các hợp chất trong đó R² là H thay vì là các nhóm khác không phải là H có sự phân bố vào chất béo giảm đi đáng kể, nhờ đó làm giảm khả năng tích lũy sinh học. Minh họa của các hợp chất có công thức 1 anilino-pyrazol được thế ở vị trí 2,6 trong đó R² là H là các hợp chất 239, 240, 241, 244, 245, 247, 252, 253, 254, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 273, 275 và 276 được nhận diện trong Bảng phụ lục A. Ngoài ra, ngoài việc có đặc tính dược động học tốt hơn ở động vật có xương sống, đã nhận thấy rằng các hợp chất có công thức 1 anilino-pyrazol được thế ở vị trí 2,6 trong đó R¹ là halogen, hoặc đặc biệt hơn là Cl hoặc Br, và R³ là F hoặc Cl, hoặc đặc biệt hơn F, có hoạt tính cao hơn đáng kể khi R² là H đối với bệnh nấm ở thực vật, chẳng hạn như bệnh do *Septoria tritici* gây ra.

Có thể đo đặc tính dược động học của hợp chất có công thức 1 bằng cách sử dụng nhiều phương pháp thử nghiệm đã biết trong lĩnh vực khoa học dược lý. Trong một phương pháp có tính chất minh họa liên quan đến việc dùng một liều qua đường miệng, ba con chuột đực và ba con chuột cái nhận một liều hợp chất thử nghiệm qua đường miệng. Khoảng 0,25 ml máu được chích ra qua tĩnh mạch đuôi ngay trước khi dùng liều, và sau đó ở 0,25, 0,5, 1, 2, 4, 8, 12, 24 h và cứ 24 h sau đó cho đến khi giết chết. Vào lúc bị giết chết, cũng gom chất béo để xác định tỷ lệ chất béo:huyết tương

lúc bị giết chết. Gom máu vào các ống chứa axit etylenđiamintetraxetic (EDTA) và ly tâm ở tốc độ 2500 x g để tách riêng huyết tương ra khỏi tế bào máu. Sau đó chiết huyết tương bằng cách kết tủa protein bằng cách sử dụng, ví dụ, axetonitril và đĩa kết tủa protein (ví dụ, Strata Impact Protein Precipitation Plate, số phần CEO-7565 của Phenomenex, Torrance, CA, U.S.A.) theo chỉ dẫn được nêu cho đĩa. Theo cách khác, huyết tương được chiết chỉ bằng axetonitril, được khuấy xoáy (tức là được khuấy trộn bằng cách sử dụng máy khuấy xoáy), và được ly tâm để tách viên protein. Sau khi loại bỏ protein, phân tích huyết tương về hợp chất gốc và/hoặc chất chuyển hoá bằng phương pháp sắc ký lỏng -phổ khối (LC/MS). Chất béo được làm đồng nhất hoá và chiết bằng dung môi hữu cơ chẳng hạn như axetonitril. Sau đó, phân tích dịch chiết về hợp chất gốc và/hoặc chất chuyển hoá bằng LC/MS. Tiếp theo, phân tích số liệu được động học trong huyết tương bằng cách sử dụng phần mềm mô hình không tuyến tính (ví dụ, WinNonlin™ từ Pharsight, Cary, NC, U.S.A.) để xác định thời gian bán huỷ của hợp chất được cấp trong huyết tương, thời gian sau khi cấp đến khi đạt đến nồng độ trong huyết tương cực đại (T_{max}), nồng độ trong huyết tương cực đại (C_{max}) và diện tích dưới đường cong nồng độ trong huyết tương (AUC). Vì việc phân tích chất béo cần phải giết chuột, thu nhận số liệu chất béo ở một điểm thời gian (tức là thời gian giết con chuột). Tuy nhiên, bằng cách sử dụng nhiều con chuột được giết chết sau các khoảng thời gian khác nhau từ thời gian dùng liều, xác định được các thông số như C_{max} cho chất béo. Bằng cách sử dụng phương pháp được mô tả trên đây, nhận thấy là các hợp chất 239, 240 và 241 được nhận diện trong Bảng phụ lục A có sự phân bố vào chất béo giảm đi đáng kể so với các hợp chất tương ứng trong đó R^2 không phải là H.

Trong chế phẩm diệt nấm theo sáng chế, các hợp chất công thức 1 của hợp phần (a) có thể có tác động hiệp đồng với các hợp chất diệt nấm bổ sung của hợp phần (b) để tạo ra các kết quả có lợi như mở rộng phổ các bệnh thực vật được phòng trừ, kéo dài thời gian bảo vệ có tác dụng phòng bệnh và điều trị, và làm giảm sự tăng nấm gây bệnh có tính kháng. Trong các phương án đặc biệt, chế phẩm được nêu ra theo sáng chế chứa tỷ lệ nhất định hợp phần (a) và hợp phần (b) là đặc biệt hữu ích phòng

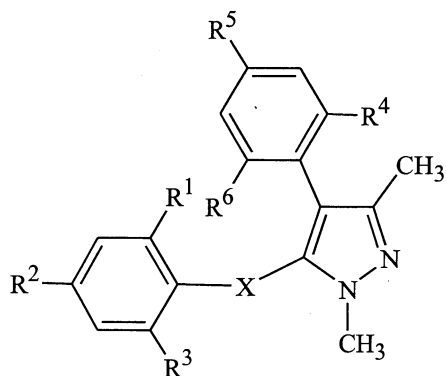
trừ các bệnh nấm cụ thể (chẳng hạn như *Alternaria solani*, *Blumeria graminis* f. sp. *tritici*, *Botrytis cinerea*, *Puccinia recondita* f. sp. *tritici*, *Rhizoctonia solani*, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*).

Hỗn hợp của các thuốc diệt nấm cũng có thể cho tác dụng phòng trừ bệnh tốt hơn đáng kể như có thể được dự đoán dựa trên hoạt tính của hợp phần đơn lẻ. Tác dụng hiệp đồng này đã được mô tả là “tác động hợp tác của hai hợp phần của hỗn hợp, sao cho tác dụng tổng là mạnh hơn hoặc kéo dài lâu hơn tổng tác dụng của hai (hoặc nhiều) thành phần được tính độc lập” (tham khảo P. M. L. Tames, *Neth. J. Plant Pathology* 1964, 70, 73–80). Trong các phương pháp tạo ra tác dụng phòng trừ bệnh cho thực vật trong đó có tác dụng hiệp đồng khi dùng kết hợp các hoạt chất (ví dụ, các hợp chất diệt nấm) lên thực vật hoặc hạt giống, các hoạt chất được dùng theo tỷ lệ khối lượng có tác dụng hiệp đồng và lượng có tác dụng hiệp đồng (tức là lượng hữu hiệu hiệp đồng) amounts. Việc đo tác dụng phòng trừ bệnh, ức chế và phòng ngừa bệnh không thể vượt quá 100%. Do đó khi dùng cụm từ tác dụng hiệp đồng đáng kể thông thường đòi hỏi việc sử dụng mức dùng các hoạt chất trong đó các hoạt chất riêng rẽ có hiệu quả nhỏ hơn 100% nhiều, sao cho tác dụng cộng hợp của chúng hầu như nhỏ hơn 100% để có thể nói rằng có khả năng tác động do tác dụng hiệp đồng. Mặc khác, mức dùng hoạt chất quá thấp có thể không thể hiện mức hoạt tính cao trong hỗn hợp ngay cả khi có tác dụng hiệp đồng. Bằng thử nghiệm đơn giản, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể nhận ra một cách dễ dàng và tối ưu hoá tỷ lệ khối lượng và mức dùng (tức là lượng) các hợp chất diệt nấm để cho tác dụng hiệp đồng.

Các thử nghiệm sau đây bao gồm các thử nghiệm thể hiện hiệu quả hợp chất theo sáng chế phòng trừ các sinh vật gây bệnh cụ thể; do đó hiệu quả này được thu nhận khi dùng các hỗn hợp diệt nấm chứa các hợp chất theo sáng chế. Các thử nghiệm sau đây còn bao gồm các thử nghiệm thể hiện hiệu quả phòng trừ của hỗn hợp theo sáng chế lên các sinh vật gây bệnh nhất định. Tuy nhiên, tác dụng phòng trừ bệnh của các hợp chất theo sáng chế khi dùng đơn lẻ hoặc trong hỗn hợp không chỉ giới hạn ở các nấm loài gây bệnh được nêu ra làm ví dụ.

Tham khảo Bảng phụ lục A về mô tả hợp chất. Tham khảo Bảng phụ lục B về số liệu nhiệt độ nóng chảy. Tham khảo Bảng phụ lục C về số liệu ^1H NMR. Các từ viết tắt sau đây được sử dụng trong các Bảng phụ lục sau đây: Me là metyl, MeO là metoxy, EtO là etoxy, và -CN là xyano. Vì có tính đối xứng, R^1 có thể được thay bằng R^3 , và R^4 có thể được thay bằng R^6 , nếu như các định nghĩa của R^1 , R^3 , R^4 và R^6 cho phép. Từ viết tắt “Cmpd.” dùng để chỉ “Hợp chất”, và từ viết tắt “Ex.” dùng để chỉ “Ví dụ” và sau đó là số biểu thị ví dụ tổng hợp mà hợp chất được điều chế từ đó. Phổ khối (M.S.) được báo cáo là trọng lượng phân tử của ion gốc dư đồng vị cao nhất ($\text{M}+1$) được tạo ra bằng cách bổ sung H^+ (trọng lượng phân tử bằng 1) vào phân tử này, được quan sát bằng phương pháp phổ khối sử dụng ion hoá hóa học áp suất khí quyển (AP^+). Sự có mặt của ion phân tử chứa một hoặc nhiều nguyên tố đồng vị có nguyên tử khối cao hơn với mức thấp hơn (ví dụ, ^{37}Cl , ^{81}Br) không được báo cáo.

Bảng phụ lục A



Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
1	F	H	H	Cl	F	H	NH	334
2	F	F	H	Cl	F	H	NH	352
3 (Ví dụ 1)	F	MeO	F	Cl	F	H	NH	**
4	F	F	F	Cl	F	H	NH	370
5	F	MeO	H	Cl	F	H	O	365
6	F	F	H	F	MeO	F	NH	366
7 (Ví dụ 2)	F	F	F	F	MeO	F	NH	**
8 (Ví dụ 6)	F	-CN	F	F	F	F	O	**
9	Cl	Cl	H	F	F	F	O	387
10	Cl	Cl	H	F	MeO	F	O	399
11	F	F	F	F	F	H	NH	354
12	F	MeO	F	F	F	H	NH	366
13 (Ví dụ 3)	F	-CN	F	Cl	F	H	O	**
14	F	-CN	F	F	MeO	H	O	374
15	F	Cl	F	F	MeO	F	O	***
16	F	MeO	F	Cl	Cl	H	NH	398
17 (Ví dụ 4)	F	F	H	Cl	Cl	H	NH	**
18	F	F	F	Cl	Cl	H	NH	386
19	F	MeO	F	F	F	F	NH	384
20	F	-CN	F	F	MeO	F	NH	391
21	F	MeO	F	F	MeO	F	NH	396
22	F	H	F	F	MeO	F	O	367
23	Cl	F	H	F	MeO	F	NH	382
24	F	Br	F	F	MeO	F	O	447

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
25	F	-CN	F	Cl	F	H	NH	377
26	F	-CN	F	F	F	F	NH	379
27	F	-CN	H	F	F	F	O	362
28	Cl	-CN	H	F	F	F	O	378
29	F	F	F	Cl	MeO	H	NH	382
30	F	F	H	F	-CN	F	NH	361
31	Cl	F	H	F	-CN	F	NH	*
32	Cl	-CN	H	F	MeO	F	NH	389
33	F	-CN	H	Cl	F	H	O	360
34	F	-CN	H	F	F	F	NH	361
35	F	F	F	F	-CN	F	NH	*
36	F	MeO	F	F	-CN	F	NH	*
37	Cl	-CN	H	Cl	F	H	O	376
38	F	-CN	F	F	MeO	F	O	392
39	F	F	H	F	EtO	F	NH	380
40	F	Cl	H	F	-CN	F	NH	*
41	F	-CN	F	Cl	MeO	H	O	390
42	F	F	H	Cl	MeO	H	NH	364
43	F	H	F	Cl	MeO	H	NH	364
44	Cl	-CN	H	Cl	F	H	NH	375
45	F	-CN	F	F	F	H	O	362
46	F	H	F	Cl	F	H	NH	352
47	Cl	F	H	Cl	F	H	NH	368
48	F	F	H	Cl	H	F	NH	352
49	F	F	H	F	H	F	NH	*
50	Cl	Cl	H	F	H	F	NH	*
51	F	MeO	H	F	H	F	NH	*
52	F	F	H	F	H	H	NH	318
53	F	F	F	F	H	H	NH	336
54	F	MeO	F	F	H	H	NH	348
55	F	MeO	F	Cl	H	F	NH	382

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
56	F	F	F	Cl	H	F	NH	369
57	F	-CN	F	Cl	H	F	NH	377
58	Cl	F	H	Cl	H	F	NH	368
59	F	-CN	H	F	H	F	NH	343
60	Cl	MeO	H	F	H	F	NH	*
61	Cl	F	H	F	F	H	NH	*
62	F	F	H	F	MeO	F	CHOH	381
63	F	MeO	H	F	F	H	NH	*
64	F	F	H	F	F	H	NH	336
65	F	-CN	F	Br	F	H	O	423
66	Cl	MeO	H	F	F	H	NH	*
67	Cl	Cl	H	F	F	H	NH	*
68	F	-CN	H	F	F	H	NH	*
69	F	H	F	F	H	F	NH	*
70	F	F	F	Br	H	H	NH	398
71	F	H	F	F	F	H	NH	*
72	F	MeO	F	F	H	F	NH	*
73	Br	F	H	Cl	F	H	NH	413
74	F	F	F	Br	F	H	NH	415
75	F	-CN	F	Cl	H	H	O	*
76	F	-CN	F	Br	H	H	O	*
77	Cl	Cl	H	Cl	MeO	H	NH	397
78	Cl	Cl	H	Cl	H	F	NH	386
79	F	-CN	H	Br	F	H	O	406
80	Cl	-CN	H	Br	F	H	O	422
81	F	Cl	F	Cl	F	H	NH	386
82	Cl	F	F	Cl	F	H	NH	386
83	F	-CN	F	F	F	H	NH	*
84	Cl	F	F	Br	F	H	NH	431
85	Cl	MeO	Cl	Cl	F	H	NH	413
86	Cl	F	F	F	H	F	NH	370

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
87	Cl	F	F	Cl	H	F	NH	386
88	Cl	Cl	H	Cl	F	H	NH	383
89	F	F	F	F	H	F	NH	*
90	F	-CN	F	F	H	F	NH	*
91	F	-CN	F	F	H	H	O	*
92	F	-CN	H	Cl	MeO	H	O	372
93	Cl	-CN	H	Cl	MeO	H	O	388
94	F	F	H	Br	F	H	NH	398
95	Br	F	H	Br	F	H	NH	458
96	Cl	F	H	Br	F	H	NH	414
97	F	F	H	Cl	H	H	NH	334
98	Cl	F	Cl	Br	F	H	NH	448
99	Cl	-CN	H	Br	MeO	H	O	433
100	F	-CN	H	Br	MeO	H	O	418
101	Cl	MeO	H	Cl	F	H	NH	380
102	Cl	MeO	Cl	Br	F	H	NH	459
103	Cl	MeO	H	Br	F	H	NH	425
104	Cl	EtO	H	Cl	F	H	NH	394
105	Cl	Cl	H	Cl	H	Cl	NH	*
106	F	-CN	F	Cl	F	F	NH	395
107	F	F	H	Cl	-CN	H	NH	359
108	Cl	F	F	Cl	-CN	H	NH	393
109	Cl	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
110	F	H	F	Cl	-CN	H	NH	359
111	F	Cl	F	Cl	-CN	H	NH	393
112	Cl	F	H	Cl	-CN	H	NH	375
113	F	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
114	Br	F	H	Cl	H	Cl	NH	*
115	Cl	F	Cl	Cl	H	Cl	NH	*
116	F	-CN	H	Cl	H	F	O	360
117	Cl	F	F	F	F	H	NH	369

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
118	Br	F	H	F	F	H	NH	398
119	F	-CN	H	F	Cl	H	O	360
120	Br	F	Cl	F	F	H	NH	432
121	F	Cl	F	F	H	F	NH	370
122 (Ví dụ 5)	F	F	H	Cl	F	H	CHOH	**
123	Cl	F	H	Cl	F	H	CHOH	383
124	F	H	F	Cl	Cl	H	NH	*
125	Cl	F	H	Cl	Cl	H	NH	*
126	F	Cl	F	F	F	H	NH	370
127	Cl	-CN	H	F	H	F	O	360
128	F	-CN	H	F	F	H	O	376
129	F	Cl	F	Br	F	H	NH	432
130	F	-CN	H	F	H	F	O	344
131	Cl	-CN	H	Cl	Cl	H	O	394
132	Cl	F	Cl	Cl	Cl	H	NH	*
133	F	Br	F	F	F	H	NH	416
134	F	Br	F	Cl	F	H	NH	432
135	F	Br	H	Cl	F	H	NH	414
136	Cl	Cl	F	Cl	F	H	NH	402
137	Cl	F	Cl	F	F	H	NH	386
138	Cl	F	Cl	Cl	F	H	NH	404
139	Br	-CN	H	F	F	H	O	406
140	Cl	-CN	H	F	F	H	O	360
141	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
142	Cl	F	Cl	F	H	F	NH	386
143	Br	F	F	F	F	H	NH	416
144	Br	F	F	Cl	F	H	NH	432
145	F	Br	F	F	H	F	NH	416
146	Br	F	F	F	H	F	NH	416
147	Br	F	F	Cl	H	F	NH	
148	F	Cl	F	Cl	F	H	CHOH	401 ‡

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
150	F	Cl	F	F	-CN	H	NH	377
151	Cl	F	F	Cl	F	H	CHOH	
152	Br	F	H	F	F	H	CHOH	
153	Br	F	H	Cl	F	H	CHOH	427 †
154	F	Br	H	F	F	H	NH	396
155	Cl	Br	Cl	F	F	H	NH	448
156	Cl	F	F	Cl	Cl	H	NH	*
157	F	Cl	F	Cl	Cl	H	NH	*
158	F	Cl	H	Cl	F	H	O	369
159	F	-CN	H	F	F	H	O	344
160	F	Cl	H	F	F	H	NH	352
161	Cl	Cl	F	F	F	H	NH	386
162	F	Cl	H	F	H	F	NH	352
163	F	Br	F	Br	F	H	NH	474
164	Cl	Br	Cl	Cl	F	H	NH	464
165	Cl	Cl	Cl	F	F	H	NH	404
167	Cl	Br	H	F	F	H	NH	414
168	Cl	Br	Cl	Br	F	H	NH	508
169	F	Br	H	Br	F	H	NH	458
170	Cl	Cl	Cl	Cl	F	H	NH	420
172	Cl	Br	H	Cl	F	H	NH	430
173	Cl	Br	H	Br	F	H	NH	474
174	Cl	Cl	Cl	Br	F	H	NH	464
175	I	F	H	F	F	H	NH	444
177	F	Cl	H	Cl	F	H	CHOH	384
178	F	F	F	Cl	F	H	CHOH	385
179	F	-CN	H	Cl	F	H	CHOH	374
180	F	Cl	I	F	F	H	NH	478
181	I	F	H	Cl	F	H	NH	460
182	F	Cl	I	Cl	F	H	NH	494
183	Br	Br	H	Cl	F	H	NH	474

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
184	Br	Br	H	F	F	H	NH	458
185	F	Cl	F	F	MeO	H	NH	382
186	F	Cl	Br	Cl	F	H	NH	448
187	F	F	Cl	F	MeO	H	NH	396
188	F	F	Cl	F	EtO	H	NH	396
189	F	Cl	F	F	EtO	H	NH	396
190	F	Cl	Cl	F	EtO	H	NH	412
191	F	Cl	Cl	F	MeO	H	NH	398
192	Cl	F	Cl	F	EtO	H	NH	412
193	F	F	H	F	EtO	H	NH	***
194	Cl	F	Cl	F	MeO	H	NH	398
195	Br	F	F	Br	F	H	NH	476
196	F	F	Cl	F	EtO	F	NH	414
197	Cl	Cl	I	Cl	F	H	NH	512
198	Cl	Cl	F	F	EtO	F	NH	430
199	F	Cl	F	F	EtO	F	NH	414
200	Cl	F	Cl	F	EtO	F	NH	430
201	F	Cl	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
202	F	Cl	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
203	F	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	398
204	F	Cl	F	Cl	MeO	H	NH	398
205	Cl	F	Cl	Cl	MeO	H	NH	416
206	F	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	412
207	F	Cl	F	Cl	EtO	H	NH	412
208	Cl	F	Cl	Cl	EtO	H	NH	430
209	F	F	H	Cl	EtO	H	NH	378
210	Cl	Cl	I	F	F	H	NH	494
211	Br	Br	F	F	F	H	NH	476
212	Br	Br	F	Cl	F	H	NH	492
213	F	F	I	Cl	F	H	NH	478
214	F	F	I	F	F	H	NH	462

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
215	F	F	I	Br	F	H	NH	524
216	F	I	F	F	F	H	NH	462
217	F	I	F	Cl	F	H	NH	478
218	F	I	F	Br	F	H	NH	524
219	I	F	F	Cl	MeO	H	NH	490
220	F	I	F	Cl	MeO	H	NH	490
221	F	F	Br	Cl	MeO	H	NH	444
222	Cl	Cl	F	I	F	H	NH	494
223	Br	Br	F	I	F	H	NH	584
224	F	Cl	F	Cl	MeO	H	CHOH	413
225	F	Cl	F	I	F	H	NH	478
226	Br	F	F	I	F	H	NH	524
227	Cl	F	Cl	F	Cl	H	NH	*
228	Cl	F	F	F	Cl	H	NH	*
229	Br	F	F	F	Cl	H	NH	*
230	F	Cl	F	F	Cl	H	NH	*
231	F	Cl	Cl	F	Cl	H	NH	*
232	Cl	F	H	F	Br	H	NH	*
233	Cl	F	Cl	F	Br	H	NH	*
234	Cl	F	F	F	Br	H	NH	*
235	Br	F	F	F	Br	H	NH	*
236	F	Cl	F	F	Br	H	NH	*
237	F	Cl	Cl	F	Br	H	NH	*
238	Cl	F	F	F	-CN	H	NH	*
239	Cl	H	F	Cl	F	H	NH	*
240 (Ví dụ 7)	Cl	H	F	Br	F	H	NH	414
241	Br	H	F	Cl	F	H	NH	414
242	Br	H	H	Br	F	H	NH	440
243	I	H	H	Br	F	H	NH	488
244	Br	H	F	Br	F	H	NH	*
245	Br	H	F	F	F	H	NH	*

Hợp chất số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	X	M.S.
246	I	H	H	F	F	H	NH	426
247	Br	H	F	F	H	F	NH	*
248	Cl	F	H	F	-CN	H	NH	***
249	Cl	F	Cl	F	-CN	H	NH	*
250	-CN	F	F	F	-CN	H	NH	*
251	Cl	H	Cl	F	F	H	NH	367
252	Me	H	F	Cl	F	H	NH	348
253	Me	H	Cl	Cl	F	H	NH	364
254	Me	H	Br	Cl	F	H	NH	410
255	Cl	H	Cl	Cl	F	H	NH	*
256	Cl	H	Cl	Br	F	H	NH	*
257	Me	H	Cl	F	MeO	H	NH	360
258	Me	H	Br	F	MeO	H	NH	406
259	Me	H	F	F	MeO	H	NH	344
260	Cl	H	F	F	MeO	H	NH	364
261	Br	H	F	F	MeO	H	NH	410
262	Me	H	Cl	Cl	MeO	H	NH	376
263	Me	H	Br	Cl	MeO	H	NH	422
264	Cl	H	F	Cl	MeO	H	NH	380
265	Me	H	Br	F	F	H	NH	394
266	Me	H	Br	Br	F	H	NH	454
267	Me	H	F	Br	F	H	NH	394
268	Me	H	F	F	F	H	NH	332
269	Me	H	Cl	F	F	H	NH	348
270	Me	H	Me	F	F	H	NH	328
271	Me	H	Me	Cl	F	H	NH	344
272	Cl	H	H	Br	F	H	NH	396
273	Br	H	F	Cl	MeO	H	NH	426
274	Br	H	H	Cl	F	H	NH	396
275	Cl	H	F	F	F	H	NH	352
276	Me	H	Cl	Br	F	H	NH	410

* Số liệu về nhiệt độ nóng chảy (MP) được liệt kê trong Bảng phụ lục B.

** Số liệu AP^+ hoặc số liệu 1H NMR được liệt kê trong các ví dụ tổng hợp.

*** Số liệu 1H NMR được liệt kê trong Bảng phụ lục C.

† Píc của ion gốc (M), không phải $M+1$, được theo dõi.

‡ Píc 402 ($M+2$) cũng được theo dõi.

Bảng phụ lục B

Hợp chất số	Nhiệt độ nóng chảy ^a	Hợp chất số	Nhiệt độ nóng chảy	Hợp chất số	Nhiệt độ nóng chảy
31	80–82	72	172–174	156	181–183
35	160–162	75	132–135	157	155–157
36	228–230	76	132–134	227	183–184
40	93–95	83	181–183	228	180–182
49	110–112	89	178–180	229	154–155
50	105–107	90	168–170	230	190–191
51	130–132	91	101–105	231	154–155
60	109–111	114	137–139	238	177–179
61	57–59	115	151–153	239	166–168
63	133–135	124	169–171	244	154–156
66	91–93	125	111–113	245	149–151
67	82–84	132	229–231	247	127–129
68	182–184	232	88–89	249	200–202
69	156–158	233	186–187	250	200–202
71	171–173	234	182–183	255	183–185
105	118–120	235	167–169	256	199–201
109	117–119	236	199–201		
113	135–136	237	160–162		

^a Nhiệt độ nóng chảy số liệu là °C.

Bảng phụ lục C

Hợp chất số	Số liệu ^1H NMR (dung dịch CDCl_3 trừ khi có quy định khác) ^a
15	δ 6,74 (m, 2H), 6,30 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 2,03 (s, 3H).
193	δ 7,01 (m, 1 H) 6,79 (ddd, 1H) 6,63 (m, 3 H) 6,34 (td, 1H) 5,34 (br s, 1H) 3,99 (m, 2H) 3,68 (s, 3H) 2,23 (s, 3H) 1,39 (m, 3H).
248	δ 7,30 (m, 2H), 7,25–7,30 (m, 1H), 7,08 (m, 1H), 6,76 (m, 1H), 6,28 (m, 1H), 5,67 (br s, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,27 (s, 3H).

a Số liệu ^1H NMR là theo ppm ở phía dưới tetrametylsilan. Các liên hợp được ký hiệu bằng (s)-vạch đơn, (br s)-vạch đơn rộng, (ddd)-vạch đôi của vạch đôi của vạch đôi, (td)-vạch ba của vạch đôi và (m)-vạch bội.

Ví dụ sinh học theo sáng chế

Phương pháp chung để điều chế huyền phù thử nghiệm cho các thử nghiệm A–J: trước hết các hợp chất thử nghiệm được hoà tan trong axeton với một lượng bằng 3% thể tích cuối và sau đó được tạo huyền phù ở nồng độ mong muốn (theo ppm) trong axeton và nước tinh khiết (hỗn hợp 50/50 theo thể tích) chứa 250 ppm chất hoạt động bề mặt Trem[®] 014 (este rượu đa chức). Sau đó huyền phù thử nghiệm thu được được sử dụng trong các thử nghiệm A–I.–Mỗi thử nghiệm được thực hiện làm ba lần, và các kết quả được lấy trung bình. Phun xịt huyền phù thử nghiệm 200 ppm vào vị trí dòng chảy trên thực vật thử nghiệm là tương đương với mức 800 g/ha. Trừ khi được quy định khác đi, các giá trị đánh giá biểu thị rằng sử dụng huyền phù thử nghiệm 200 ppm. (dấu hoa thị “*” bên cạnh giá trị đánh giá biểu thị rằng sử dụng huyền phù thử nghiệm 40 ppm.)

Thử nghiệm A

Phun huyền phù thử nghiệm vào vị trí dòng chảy trên cây cà chua con. Ngày hôm sau gây nhiễm các cây con này huyền phù chứa bào tử *Botrytis cinerea* (tác nhân gây bệnh nấm mạng nhện cây cà chua) và được ủ trong trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 48 h, và sau đó di chuyển đến buồng sinh trưởng ở nhiệt

độ 24 °C trong thời gian 3 ngày nữa, sau thời gian đó đánh giá mức độ bệnh bằng quan sát.

Thử nghiệm B

Phun huyền phù thử nghiệm này vào vị trí dòng chảy trên cây cà chua con. Ngày hôm sau gây nhiễm các cây con này bằng huyền phù chứa bào tử *Alternaria solani* (tác nhân gây bệnh úa sớm cây cà chua) và được ủ trong trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 27 °C trong thời gian 48 h, và sau đó di chuyển đến buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 5 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ bệnh bằng quan sát.

Thử nghiệm C

Phun huyền phù thử nghiệm vào vị trí dòng chảy trên cây cà chua con. Ngày hôm sau, gây nhiễm các cây con này bằng huyền phù chứa bào tử *Phytophthora infestans* (tác nhân gây bệnh héo muộn cây cà chua) và được ủ trong trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 24 h, và sau đó di chuyển đến buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 5 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ bệnh bằng quan sát.

Thử nghiệm D

Phun huyền phù thử nghiệm này vào vị trí dòng chảy trên cây cỏ creeping crabgrass (*Agrostis* sp.). Ngày hôm sau gây nhiễm các cây con này bằng huyền phù chứa *Rhizoctonia solani* trong cám và nấm (tác nhân gây bệnh đốm nâu ở cỏ) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 27 °C trong thời gian 48 h, và sau đó di chuyển đến buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 27 °C trong thời gian 3 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ bệnh.

Thử nghiệm E

Phun huyền phù thử nghiệm lên điểm chảy xối trên cây lúa mì con. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy huyền phù chứa bào tử *Septoria nodorum* (tác nhân gây bệnh đốm mây do *Septoria*) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 24 °C trong thời gian 48 h, và sau đó được đưa đến phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 9 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Thử nghiệm F

Phun huyền phù thử nghiệm này vào vị trí dòng chảy trên cây con lúa mì. Ngày hôm sau gây nhiễm các cây con này bằng huyền phù chứa bào tử *Septoria tritici* (tác nhân gây bệnh đốm lá lúa mì) và ủ trong trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 24 °C trong thời gian 48 h. và sau đó các cây con này được chuyển đến buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong 19 ngày nữa, sau thời gian đó đánh giá mức độ bệnh bằng quan sát.

Thử nghiệm G

Cây con lúa mì được cấy huyền phù chứa bào tử *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (tác nhân gây bệnh gỉ sắt lá cây lúa mì) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 24 h, và sau đó được đưa đến phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 2 ngày. Vào cuối thời gian này, huyền phù thử nghiệm được phun lên điểm chảy xối, và sau đó các cây con được đưa đến hòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 4 ngày sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Thử nghiệm H

Huyền phù thử nghiệm được phun lên điểm chảy xối trên cây con lúa mì. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy huyền phù chứa bào tử *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (tác nhân gây bệnh gỉ sắt lá cây lúa mì) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 24 h, và sau đó được đưa đến phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 6 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Thử nghiệm I

Phun huyền phù thử nghiệm lên điểm chảy xối trên cây con lúa mì. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy bằng bụi bào tử *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (còn được biết đến là *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, tác nhân gây bệnh nấm mốc bột lúa mì)) và được ủ trong phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 8 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Các kết quả của các thử nghiệm A–I được nêu ở Bảng A. Trong Bảng này, mức đánh giá 100 dùng để chỉ tác động phòng trừ bệnh 100% bệnh và mức đánh giá 0

biểu thị rằng không có tác động phòng trừ bệnh (so với đối chứng). Đường kẻ ngang (–) biểu thị rằng không có kết quả thử nghiệm.

Bảng A

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
1	99	93	0	99	0	100	-	99	100
2	99	100	0	98	64	100	-	100	99
3	100	100	-	-	93	97	96	100	100
4	99	100	-	-	99	95	99	100	100
5	98	100	-	-	97	97*	-	100	99
6	98	100	-	-	99	93	92	100	100
7	98	100	-	-	0	94	9	97	100
8	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
9	99	9	-	-	0	97	0	99	99
10	99	0	-	-	0	94	92	99	99
11	100	99	-	-	90	94	0	100	99
12	100	0	-	-	0	93	0	94	82
13	100	100	-	-	100	100	7	100	100
14	99	100	-	-	99	100	37	100	99
15	98	100	-	-	89	98	82	100	100
16	99	98	-	-	84	98	98	99	99
17	100	73	-	-	60	99	91	99	100
18	100	98	-	-	98	99	95	99	97
19	99	82	-	-	0	98	0	89	91
20	100	100	-	-	40	99	0	68	13
21	100	100	-	-	89	99	99	96	94
22	100	100	-	-	78	100	98	100	99
23	100	100	-	-	95	98	85	99	100
24	99	95	-	-	84	100	0	98	100
25	100	99	-	-	95	99	0	100	100
26	100	100	-	-	99	100	41	99	100
27	99	99	-	-	99	100	9	99	100
28	100	17	-	-	69	100	26	99	99
29	100	99	-	-	97	99	99	99	100
30	100	99	-	-	90	100	82	99	100
31	100	98	-	-	99	99	53	100	100

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
32	99	97	-	-	82	100	11	98	97
33	100	100	-	-	98	100	99	100	99
34	100	99	9	-	94	100	0	99	99
35	100	100	-	-	60	99	0	100	94
36	99	0	-	-	0	99	0	41	0
37	100	86	-	-	100	100	69	99	100
38	99	94	-	-	87	99	0	96	97
39	99	99	-	-	98	100	0	99	100
40	99	99	-	-	100	100	63	100	100
41	100	99	-	-	100	100	92	100	99
42	98	99	-	-	0	99	8	100	100
43	98	100	-	-	0	100	95	100	98
44	99	0	-	-	0	99	8	98	94
45	100	99	0	-	99	98	0	100	99
46	100	100	-	-	87	100	0	99	100
47	100	99	0	-	82	96	93	99	100
48	100	100	-	-	73	98	0	83	100
49	100	100	-	-	80	98	0	83	100
50	100	99	-	-	73	95	0	93	100
51	100	99	-	-	0	98	0	68	100
52	94	44	-	-	0	100	0	60	98
53	97	99	-	-	87	100	0	95	99
54	97	100	-	-	67	99	27	94	99
55	99	99	-	-	80	100	94	100	99
56	98	100	-	-	0	100	0	97	99
57	97	100	-	-	73	100	0	99	99
58	99	100	-	-	0	100	32	99	100
59	99	94	0	-	73	100	9	98	98
60	99	97	-	-	20	100	18	97	99
61	100	93	-	-	64	100	0	99	100
62	100	100	-	-	99	100	0	99	99
63	99	99	-	-	0	99	0	80	99
64	99	99	-	-	0	100	0	97	100
65	100	99	-	-	99	100	0	100	100
66	99	37	-	-	0	100	0	91	100

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
67	100	64	-	-	0	100	0	97	100
68	99	51	-	-	0	100	0	80	100
69	100	99	-	-	60	100	0	99	100
70	99	26	-	-	73	100	0	99	100
71	99	99	-	-	96	100	0	99	100
72	100	99	-	-	0	100	0	97	98
73	100	99	-	-	78	100	90	100	100
74	100	100	-	-	98	100	0	100	100
75	100	99	-	-	99	100	0	99	98
76	100	97	-	-	99	99	0	99	99
77	99	98	-	-	0	99*	0	99	100
78	99	65	-	-	0	99*	9	99	100
79	99	99	-	-	100	100*	28	100	100
80	98	0	-	-	60	100*	9	99	99
81	100	99	0	-	90	100	99	100	100
82	99	100	0	-	100	100	97	100	100
83	100	99	-	-	87	100	0	100	100
84	100	99	-	-	96	100	92	100	100
85	99	0	-	-	0	100	0	99	99*
86	100	99	-	-	90	100	0	100	100
87	100	93	-	-	87	100	0	100	100
88	100	95	-	-	51	100*	41	100	100
89	100	99	-	-	82	100	9	99	100
90	99	87	-	-	87	100	0	98	99
91	99	99	-	-	94	100	0	99	99
92	100	99	-	-	99	100	0	99	96
93	100	0	-	-	60	100	0	99	91
95	100	97	-	-	51	100	91	100	100
96	100	95	-	-	0	100	94	100	100
97	99	99	-	-	0	100	0	96	100
98	99	0	-	-	0	99	9	99	96
99	99	0	-	-	0	100	0	97	89
100	92	88	-	-	100	100	0	99	95
101	100	93	-	-	0	100	99	100	100
102	98	0	-	-	0	98	0	94	95*

Hợp chất số	Thử nghiem A	Thử nghiem m B	Thử nghiem C	Thử nghiem D	Thử nghiem E	Thử nghiem F	Thử nghiem G	Thử nghiem H	Thử nghiem I
103	99	83	-	-	0	100	63	99	99
104	100	0	-	-	0	100	0	97	99
105	99	0	-	-	0	100	0	96	99
107	100	80	-	-	73	100	8	100	97
109	100	0	-	-	0	100	0	97	100
111	100	97	-	-	95	100	94	100	99
112	100	37	-	-	40	100	8	100	99
113	100	0	-	-	0	100	0	98	100
114	99	0	-	-	0	100	0	91	100
115	99	0	-	-	0	99	0	99	93
116	100	33	-	-	99	100	0	100	100
117	100	100	-	-	97	100	91	100	100
118	100	93	-	-	69	100	75	97	100
119	99	94	-	-	94	100	0	91	99
120	100	80	-	-	94	100	19	100	100
122	100	99	-	-	92	100	96	100	99
123	100	86	-	-	60	100	6	100	95
124	97	17	-	-	0	99	3	99	99
125	99	0	-	-	0	100	82	98	100
126	100	86	-	-	87	100	0	99	100
127	99	0	-	-	0	100	0	97	97
128	100	99	-	-	97	100	0	100	99
129	100	97	-	-	95	100	79	100	100
130	100	90	-	-	0	100	0	100	100
131	100	0	-	-	0	100	0	96	96
132	93 (Lưu ý 1)	0	-	-	0	99	0	96	43
133	99	97	-	-	88	100	0	99	100
134	100	99	-	-	64	100	74	100	100
135	100	58	-	-	0	100	9	99	100
136	100	100	0	-	100	100	100	100	100
137	100	95	-	-	87	100	87	99	100
138	100	66	0	-	0	100	17	100	99
139	82	0	-	-	0	100	9	89	0
140	67	0	-	-	0	100	9	97	97

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
141	99	99	-	-	99	100	97	100	100
142	100	96	0	-	92	100	0	100	100
143	100	100	0	-	100	100	100	100	100
144	100	99	-	-	100	100	100	100	100
145	99	0	0	-	0	100	0	28	90
146	-	100	0	-	100	100	74	98	100
148	100	0	-	-	60	100	0	100	64
150	100	-	-	-	-	100	-	100	100
153	-	0	-	-	0	100	0	96	0
154	100	9	-	-	0	100	68	98	99
155	100	0	-	-	0	100	94	97	99
156	100	99	-	-	73	100	31	99	99
157	100	97	0	-	87	100	27	100	99
158	100*	80*	-	-	0*	99*	37*	98*	96*
159	100*	97*	-	-	86*	100*	0*	98*	96*
160	100	99	-	-	0	100	0	99	100
161	100	99	0	-	100	99	100	100	100
162	100	88	0	-	0	100	9	100	100
163	100*	77*	-	-	60*	100*	91*	100*	100*
164	99	0	-	-	0	100	99	100	99
165	100	0	0	-	0	100	67	99	99
167	100	0	-	-	0	100	6	92	98
168	0	0	-	-	0	100	97	91	48
169	100	0	-	-	60	100	23	96	99
170	65	0	-	-	0	100	79	98	79
172	100	73	-	-	60	100	0	100	100
173	100	0	-	-	40	100	0	99	99
174	95	0	-	-	0	100	0	99	99*
175	100	97	-	-	73	100	41	100	100
177	99	0	-	-	0	-	0	0	48
178	100	33	-	-	0	-	98	100	74
179	96	16	-	-	0	-	9	99	0
180	100	100	9	-	99	100	98	100	100
181	100	99	-	-	99	100	99	99	100
182	100	100	-	-	100	100	100	100	100

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
183	100	0	-	-	0	100	54	96	98
184	100	58	-	-	60	100	0	98	100
185	100	99	0	-	60	100	0	99	100
186	100	100	0	-	100	100	100	100	100
187	100	100	0	-	89	-	32	100	100
188	100	99	0	-	92	-	0	98	98
189	100	88	0	-	90	-	0	98	98
190	100	82	0	-	0	-	9	96	95
191	100	99	0	-	92	-	46	99	99
192	33	66	0	-	0	100	0	65	35
193	-	58	-	-	0	100	0	27	92
194	-	93	-	-	87	100	0	95	63
195	99	100	0	-	99	100	89	100	100
196	100	100	0	-	95	100	0	94	100
197	100	77	-	-	0	100	9	97	94
198	100	100	-	-	60	100	9	80	96
199	100	100	68	-	69	100	0	83	99
200	98	97	31	-	0	100	0	86	79
201	100	100	-	-	99	100	98	100	97
202	99	77	-	-	0	100	35	92	95
203	95	100	-	-	73	100	79	100	98
204	99	99	-	-	99	100	99	100	100
205	59	31	-	-	0	100	0	99	21
206	99	100	-	-	99	100	0	99	100
207	94	99	-	-	86	100	0	94	99
208	18	0	-	-	0	99	0	85	27
209	98	95	-	-	0	100	0	92	100
210	3	0	-	-	0	100	0	97	0
211	98	99	-	-	99	100	82	100	100
212	98	100	-	-	100	100	97	100	100
213	100	100	-	-	100	100	100	100	100
214	100	100	-	-	99	100	99	99	100
215	100	100	-	-	99	100	100	100	100
216	100	0	-	-	60	100	18	95	99
217	100	58	-	-	86	100	41	99	99

Hợp chất số	Thử nghiem A	Thử nghiem m B	Thử nghiem C	Thử nghiem D	Thử nghiem E	Thử nghiem F	Thử nghiem G	Thử nghiem H	Thử nghiem I
218	100	68	-	-	86	100	0	99	99
219	100	100	-	-	100	100	99	100	99
220	100	69	-	-	73	100	0	97	96
221	100	100	-	-	97	100	73	99	100
222	98	77	-	-	0	100	0	90	96
223	98	88	-	-	0	100	0	97	99
224	-	100	-	-	89	100	54	100	94
225	99	68	-	-	0	100	0	99	100
226	97	97	-	-	60	100	0	99	100
227	0	0	-	-	0	100	0	95	96
228	68	40	-	-	0	100	0	96	81
229	99	99	-	-	64	100	9	97	98
230	40	0	-	-	0	100	0	94	95
231	33	58	-	-	0	100	9	94	99
232	79	-	-	-	-	100	-	90	99
233	36	-	-	-	-	100	-	91	89
234	97	-	-	-	-	100	-	91	79
235	99	-	-	-	-	100	-	96	90
236	47	-	-	-	-	100	-	28	0
237	99	-	-	-	-	100	-	92	95
238	100	-	-	-	-	100	-	100	100
239	100	100	0	-	99	100	100	100	99
240	100	-	-	-	-	100	-	100	100
241	100	-	-	-	-	100	-	100	100
242	99*	-	-	-	-	100*	-	96*	99*
243	100	-	-	-	-	100	-	99	100
244	100	-	-	-	-	100	-	100	100
245	100	-	-	-	-	100	-	100	100
246	100	-	-	-	-	100	-	98	99
247	100	-	-	-	-	100	-	100	100
248	99	-	-	-	-	100	-	99	99
249	100	-	-	-	-	100	-	98	92
250	0	-	-	-	-	100	-	100	89
251	100	-	-	-	-	100	-	100	100
252	100	-	-	-	-	100	-	100	100

Hợp chất số	Thử nghiệm A	Thử nghiệ m B	Thử nghiệm C	Thử nghiệm D	Thử nghiệm E	Thử nghiệm F	Thử nghiệm G	Thử nghiệm H	Thử nghiệm I
253	100	-	-	-	-	100	-	100	100
254	100	-	-	-	-	100	-	100	100
255	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	81*
256	99*	-	-	-	-	100*	-	95*	64*
257	100*	-	-	-	31*	100*	-	63*	27*
258	100*	-	-	-	0*	100*	-	9*	0*
259	100*	-	-	-	0*	100*	-	82*	90*
260	100*	-	-	-	0*	100*	-	85*	90*
261	-	-	-	-	0*	100*	-	97*	95*
262	97*	-	-	-	0*	100*	-	85*	79*
263	99*	-	-	-	0*	100*	-	79*	13*
264	100*	-	-	-	0*	100*	-	97*	81*
265	100	-	-	-	-	100	-	99	100
266	99	-	-	-	-	100	-	99	99
267	100	-	-	-	-	100	-	100	100
268	100	-	-	-	-	100	-	99	100
269	100	-	-	-	-	100	-	99	100
270	98*	-	-	-	-	100*	-	41*	91*
271	99*	-	-	-	-	100*	-	97*	98*
272	100	-	-	-	-	100	-	99	100
275	100	99	0	-	60	100	9	95	100
276	100*	-	-	-	-	100*	-	99*	92*

“Hợp chất số ” dùng để chỉ số hợp chất.

Số 1: Mức đánh giá là “65” trong thử nghiệm trước.

Các thử nghiệm K, L và M

Phương pháp chung để điều chế chế phẩm thử nghiệm cho các thử nghiệm K, L và M là như sau. Hợp chất 81, bixafen, 5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin (BAS600), cyproconazole, isopyrazam, penthiopyrad, probenazole, quinoxifen và spiroxamin được dùng dưới dạng chất tinh khiết cấp kỹ thuật không được chế hóa. Azoxystrobin, boscalid, chlorothalonil, đồng hydroxit, cymoxanil, difenoconazole, dimethomorph,

epoxiconazole, fenpropimorph, fluazinam, fludioxonil, folpet, iprodione, iprovalicarb, mancozeb, mefenoxam (còn được biết đến là metalaxyl-M), myclobutanil, picoxystrobin, proquinazid, prothioconazole, pyraclostrobin, tetraconazole và tricyclozole được dùng là dạng sản phẩm được lưu hành trên thị trường được chế hóa lần lượt dưới tên nhãn hiệu AMISTAR, ENDURA, BRAVO, KOCIDE, CURZATE, SCORE, ACROBAT, OPUS, CORBEL, OMEGA, MAXIM, PHALTAN, ROVRAL, MELODY, MANZATE, RIDOMIL GOLD, NOVA, ACANTO, TALIS, PROLIN, HEADLINE, DOMARK và BEAM. Chất liệu không được chế hóa trước hết được hoà tan trong axeton và sau đó được tạo huyền phù ở nồng độ mong muốn (theo ppm) trong axeton và nước tinh khiết (hỗn hợp 50/50 thể tích) chứa 250 ppm chất hoạt động bề mặt Trem® 014 (este rượu đa chức). Chất liệu được chế hóa được phân tán trong lượng đủ nước để tạo ra nồng độ mong muốn, và không cho dung môi hữu cơ hay chất hoạt động bề mặt vào huyền phù này. Sau đó, các hỗn hợp thử nghiệm thu được được sử dụng trong các thử nghiệm K, L và M. Phun huyền phù thử nghiệm với lượng 200 ppm vào điểm chảy xối trên cây thử nghiệm tương đương với mức vào khoảng 800 g/ha. Các thử nghiệm này được lặp lại ba lần và các kết quả được báo cáo là trung bình của ba lần lặp lại.

Xác định sự có mặt của tác dụng hiệp đồng giữa hai hoạt chất nhờ phương trình Colby (tham khảo Colby, S. R. Colby, S. R. “Tính toán Hiệp đồng and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations”, *Weeds*, (1967), 15, 20-22):

$$p = A + B - \left[\frac{A \times B}{100} \right]$$

Bằng cách sử dụng phương pháp Colby, sự có mặt của tương tác hiệp đồng giữa hai hoạt chất trước hết bằng cách tính toán hoạt tính dự đoán, p, của hỗn hợp dựa trên hoạt tính của hai hợp phần khi được dùng đơn lẻ. Nếu giá trị p nhỏ hơn tác dụng đo được bằng thử nghiệm, khi đó đã có tác dụng hiệp đồng. Trong phương trình nêu trên, A là hoạt tính diệt nấm tính theo phần trăm phòng trừ của một hợp phần khi được dùng đơn lẻ ở mức x. Giá trị B là hoạt tính diệt nấm tính theo phần trăm phòng trừ của

hợp phần thứ hai khi được dùng ở mức y. Phương trình này ước tính giá trị p, là hoạt tính diệt nấm dự tính của hỗn hợp gồm A ở mức x cùng với B ở mức y nếu như tác động giữa chúng tuân theo tác dụng cộng hợp và không có tương tác xuất hiện.

Thử nghiệm K (tức là thử nghiệm K1, K2, K3, K4, K5)

Phun huyền phù thử nghiệm này vào điểm chảy xối trên cây con lúa mì. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy bột bào tử *Blumeria graminis* f. sp. *tritici*, (còn được biết đến là *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, là tác nhân gây bệnh phấn trắng cây lúa mì) và được ủ trong phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 7 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Thử nghiệm L (tức là thử nghiệm L1, L2, L3, L4, L5)

Phun huyền phù thử nghiệm vào điểm chảy xối trên cây con lúa mì. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy huyền phù chứa bào tử *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (tác nhân gây bệnh gỉ sắt lá cây lúa mì) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 24 h, và sau đó được đưa đến phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong thời gian 6 ngày, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Thử nghiệm M (tức là thử nghiệm M1, M2, M3, M4, M5)

Phun huyền phù thử nghiệm vào điểm chảy xối trên cây con lúa mì. Vào ngày tiếp theo các cây con được cấy huyền phù chứa bào tử của *Septoria tritici* (tác nhân gây bệnh đốm lá lúa mì) và được ủ trong khí quyển bão hoà ở nhiệt độ 24 °C trong thời gian 48 giờ và sau đó các cây con được đưa đến phòng sinh trưởng ở nhiệt độ 20 °C trong 19 ngày nữa, sau thời gian đó đánh giá mức độ gây bệnh bằng mắt.

Các kết quả cho các thử nghiệm K–M được trình bày trong các Bảng B đến K sau đây. Mức 100 biểu thị tác dụng phòng trừ bệnh 100% và mức 0 biểu thị rằng không có tác dụng phòng trừ bệnh (so với mẫu đối chứng). Dấu gạch ngang (–) biểu thị không có kết quả thử nghiệm. Cột được ghi “Thu được” biểu thị giá trị trung bình của các kết quả thu được từ ba lần lặp lại. Cột được ghi “Dự tính” biểu thị tác dụng dự đoán cho mỗi hỗn hợp xử lý được tính toán bằng cách sử dụng phương trình Colby.

Bảng B

Hiệu quả thu được và dự tính của Hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Quinoxifen, Probenazole, Mancozeb, Iprodione, Boscalid, đồng Hydroxit, Cymoxanil hoặc Proquinazid để phòng trừ bệnh phấn trắng lúa mì hoặc bệnh gỉ sắt ở lá

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K1		Thử nghiệm L1	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0		0	
1	không có mặt	0	0		88	
2	không có mặt	0	87		68	
5	không có mặt	0	99		91	
10	không có mặt	0	100		98	
0	quinoxifen	10			0	
0	quinoxifen	40			0	
0	quinoxifen	200			0	
2	quinoxifen	10			18	68
2	quinoxifen	40			23	68
2	quinoxifen	200			38	68
5	quinoxifen	10			60	91
5	quinoxifen	40			41	91
5	quinoxifen	200			47	91
0	probenazole	10	68		9	
0	probenazole	40	21		18	
0	probenazole	200	71		18	
2	probenazole	10	97	96	54	71
2	probenazole	40	99	90	85	74
2	probenazole	200	98	96	74	74
5	probenazole	10	100	100	92	92
5	probenazole	40	100	99	96	93

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K1		Thử nghiệm L1	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
5	probenazole	200	100	100	94	93
0	mancozeb	10	0		54	
0	mancozeb	40	0		88	
0	mancozeb	200	0		98	
2	mancozeb	10	79	87	80	85
2	mancozeb	40	87	87	91	96
2	mancozeb	200	84	87	99	99
5	mancozeb	10	96	99	85	96
5	mancozeb	40	99	99	98	99
5	mancozeb	200	99	99	99	100
0	iprodione	10	0		0	
0	iprodione	40	0		0	
0	iprodione	200	21		0	
2	iprodione	10	96	87	27	68
2	iprodione	40	92	87	27	68
2	iprodione	200	94	90	41	68
5	iprodione	10	99	99	68	91
5	iprodione	40	99	99	80	91
5	iprodione	200	99	99	85	91
0	boscalid	10	0		0	
0	boscalid	40	0		54	
0	boscalid	200	0		92	
2	boscalid	10	0	87	76	68
2	boscalid	40	0	87	86	85
2	boscalid	200	64	87	99	97
5	boscalid	10	86	99	89	91
5	boscalid	40	94	99	98	96
5	boscalid	200	97	99	98	99

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K1		Thử nghiệm L1	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	đồng hydroxit	10	0		0	
0	đồng hydroxit	40	0		0	
0	đồng hydroxit	200	0		0	
2	đồng hydroxit	10	71	87	9	68
2	đồng hydroxit	40	0	87	0	68
2	đồng hydroxit	200	0	87	0	68
5	đồng hydroxit	10	97	99	41	91
5	đồng hydroxit	40	94	99	18	91
5	đồng hydroxit	200	93	99	41	91
0	cymoxanil	10	0		0	
0	cymoxanil	40	0		0	
0	cymoxanil	200	50		18	
2	cymoxanil	10	73	87	9	68
2	cymoxanil	40	89	87	9	68
2	cymoxanil	200	91	93	54	74
5	cymoxanil	10	96	99	18	91
5	cymoxanil	40	98	99	54	91
5	cymoxanil	200	97	100	74	93
0	proquinazid	10			0	
0	proquinazid	40			0	
0	proquinazid	200			0	
2	proquinazid	10			0	68
2	proquinazid	40			18	68
2	proquinazid	200			27	68
5	proquinazid	10			18	91
5	proquinazid	40			27	91
5	proquinazid	200			68	91

Bảng C

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Chlorothalonil, Tricyclazole, Fluazinam, Dimethomorph, Fludioxonil, Iprovalicarb, Metalaxyl-M hoặc Folpet để phòng trừ bệnh phấn trắng lúa mì hoặc bệnh gỉ sắt ở lá

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K2		Thử nghiệm L2	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	63		0	
1	không có mặt	0	91		9	
2	không có mặt	0	91		27	
5	không có mặt	0	91		74	
10	không có mặt	0	100		91	
0	chlorothalonil	10	58		0	
0	chlorothalonil	40	68		41	
0	chlorothalonil	200	79		91	
2	chlorothalonil	10	92	96	18	27
2	chlorothalonil	40	100	97	85	57
2	chlorothalonil	200	97	98	96	93
5	chlorothalonil	10	100	96	66	74
5	chlorothalonil	40	100	97	88	85
5	chlorothalonil	200	100	98	96	98
0	tricyclazole	10	0		0	
0	tricyclazole	40	29		0	
0	tricyclazole	200	79		0	
2	tricyclazole	10	99	91	27	27
2	tricyclazole	40	99	94	27	27
2	tricyclazole	200	98	98	27	27
5	tricyclazole	10	100	91	55	74
5	tricyclazole	40	100	94	68	74
5	tricyclazole	200	100	98	80	74
0	fluazinam	10	85		18	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K2		Thử nghiệm L2	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	fluazinam	40	96		41	
0	fluazinam	200	100		74	
2	fluazinam	10	84	99	41	41
2	fluazinam	40	99	100	68	57
2	fluazinam	200	99	100	91	81
5	fluazinam	10	100	99	80	79
5	fluazinam	40	100	100	80	85
5	fluazinam	200	100	100	91	93
0	dimethomorph	10	82		9	
0	dimethomorph	40	71		9	
0	dimethomorph	200	82		0	
2	dimethomorph	10	99	98	18	34
2	dimethomorph	40	100	98	18	34
2	dimethomorph	200	99	98	27	27
5	dimethomorph	10	100	98	60	76
5	dimethomorph	40	100	98	68	76
5	dimethomorph	200	100	98	68	74
0	fludioxonil	10	82		0	
0	fludioxonil	40	92		0	
0	fludioxonil	200	96		9	
2	fludioxonil	10	100	98	27	27
2	fludioxonil	40	99	99	27	27
2	fludioxonil	200	100	100	27	34
5	fludioxonil	10	100	98	41	74
5	fludioxonil	40	100	99	55	74
5	fludioxonil	200	100	100	74	76
0	iprovalicarb	10	71		0	
0	iprovalicarb	40	74		0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K2		Thử nghiệm L2	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	iprovalicarb	200	56		9	
2	iprovalicarb	10	100	98	27	27
2	iprovalicarb	40	100	98	27	27
2	iprovalicarb	200	99	96	27	34
5	iprovalicarb	10	100	98	74	74
5	iprovalicarb	40	100	98	74	74
5	iprovalicarb	200	100	96	85	76
0	metalaxyl-M	10	56		0	
0	metalaxyl-M	40	64		0	
0	metalaxyl-M	200	21		0	
2	metalaxyl-M	10	96	96	27	27
2	metalaxyl-M	40	99	97	27	27
2	metalaxyl-M	200	99	93	27	27
5	metalaxyl-M	10	100	96	55	74
5	metalaxyl-M	40	100	97	55	74
5	metalaxyl-M	200	100	93	68	74
0	folpet	10	0		0	
0	folpet	40	0		27	
0	folpet	200	21		55	
2	folpet	10	93	91	0	27
2	folpet	40	96	91	27	47
2	folpet	200	66	93	80	67
5	folpet	10	100	91	74	74
5	folpet	40	100	91	88	81
5	folpet	200	100	93	93	88

Bảng D

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Isopirazam, BAS600, Bixafen, Penthiopyrad, Spiroxamin, Myclobutanil hoặc Fenpropimorph để phòng trừ bệnh phấn trắng cây lúa mì hoặc bệnh gỉ sắt ở lá

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K3		Thử nghiệm L3	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0		0	
1	không có mặt	0	0		9	
2	không có mặt	0	0		9	
5	không có mặt	0	90		41	
10	không có mặt	0	99		88	
0	isopirazam	0,08	0			
0	isopirazam	0,4	50			
0	isopirazam	2	99			
0	isopirazam	10	99			
2	isopirazam	0,08	0	0		
2	isopirazam	0,4	64	50		
2	isopirazam	2	94	99		
2	isopirazam	10	100	99		
5	isopirazam	0,08	99	90		
5	isopirazam	0,4	100	95		
5	isopirazam	2	100	100		
5	isopirazam	10	100	100		
0	BAS600	0,08	0		74	
0	BAS600	0,4	0		88	
0	BAS600	2	96		99	
0	BAS600	10	100		100	
2	BAS600	0,08	0	0	74	76
2	BAS600	0,4	0	0	94	89
2	BAS600	2	93	96	100	99

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K3		Thử nghiệm L3	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
2	BAS600	10	99	100	100	100
5	BAS600	0,08	100	90	92	84
5	BAS600	0,4	99	90	99	93
5	BAS600	2	100	100	100	99
5	BAS600	10	100	100	100	100
0	bixafen	0,08	0		9	
0	bixafen	0,4	0		88	
0	bixafen	2	64		99	
0	bixafen	10	99		100	
2	bixafen	0,08	0	0	18	17
2	bixafen	0,4	0	0	80	89
2	bixafen	2	90	64	99	99
2	bixafen	10	99	99	100	100
5	bixafen	0,08	99	90	68	46
5	bixafen	0,4	100	90	94	93
5	bixafen	2	100	96	100	99
5	bixafen	10	100	100	100	100
0	penthiopyrad	0,08	0			
0	penthiopyrad	0,4	0			
0	penthiopyrad	2	99			
0	penthiopyrad	10	100			
2	penthiopyrad	0,08	0	0		
2	penthiopyrad	0,4	42	0		
2	penthiopyrad	2	99	99		
2	penthiopyrad	10	100	100		
5	penthiopyrad	0,08	99	90		
5	penthiopyrad	0,4	100	90		
5	penthiopyrad	2	100	100		

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K3		Thử nghiệm L3	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
5	penthiopyrad	10	100	100		
0	spiroxamin	0,4	0		0	
0	spiroxamin	2	0		0	
0	spiroxamin	10	0		0	
0	spiroxamin	40	99		91	
2	spiroxamin	0,4	0	0	18	9
2	spiroxamin	2	0	0	9	9
2	spiroxamin	10	0	0	9	9
2	spiroxamin	40	100	99	60	92
5	spiroxamin	0,4	97	90	45	41
5	spiroxamin	2	96	90	41	41
5	spiroxamin	10	98	90	80	41
5	spiroxamin	40	100	100	95	95
0	myclobutanil	0,4	0		0	
0	myclobutanil	2	86		0	
0	myclobutanil	10	99		41	
0	myclobutanil	40	100		99	
2	myclobutanil	0,4	42	0	0	9
2	myclobutanil	2	93	86	0	9
2	myclobutanil	10	100	99	41	46
2	myclobutanil	40	100	100	100	99
5	myclobutanil	0,4	98	90	27	41
5	myclobutanil	2	99	99	68	41
5	myclobutanil	10	100	100	93	65
5	myclobutanil	40	100	100	100	99
0	fenpropimorph	0,4	50		0	
0	fenpropimorph	2	96		0	
0	fenpropimorph	10	100		88	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K3		Thử nghiệm L3	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	fenpropimorph	40	100		100	
2	fenpropimorph	0,4	85	50	0	9
2	fenpropimorph	2	97	96	41	9
2	fenpropimorph	10	100	100	97	89
2	fenpropimorph	40	100	100	100	100
5	fenpropimorph	0,4	96	95	54	41
5	fenpropimorph	2	100	100	83	41
5	fenpropimorph	10	100	100	99	93
5	fenpropimorph	40	100	100	100	100

Bảng E

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Difenconazole, Azoxystrobin, Tetraconazole, Pyraclostrobin, Prothioconazole, Picoxystrobin hoặc Epoxiconazole để phòng trừ bệnh phấn trắng cây lúa mì hoặc bệnh gỉ sắt ở lá

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K4		Thử nghiệm L4	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0		0	
1	không có mặt	0	0		0	
2	không có mặt	0	0		27	
5	không có mặt	0	0		68	
10	không có mặt	0	—		88	
0	difenconazole	0,08	0			
0	difenconazole	0,4	0			
0	difenconazole	2	81			
0	difenconazole	10	99			
2	difenconazole	0,08	0	0		
2	difenconazole	0,4	21	0		
2	difenconazole	2	90	81		
2	difenconazole	10	100	99		
5	difenconazole	0,08	98	0		
5	difenconazole	0,4	97	0		
5	difenconazole	2	98	81		
5	difenconazole	10	100	99		
0	azoxystrobin	0,08	0			
0	azoxystrobin	0,4	0			
0	azoxystrobin	2	0			
0	azoxystrobin	10	96			
2	azoxystrobin	0,08	0	0		
2	azoxystrobin	0,4	0	0		

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K4		Thử nghiệm L4	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
2	azoxystrobin	2	0	0		
2	azoxystrobin	10	97	96		
5	azoxystrobin	0,08	97	0		
5	azoxystrobin	0,4	96	0		
5	azoxystrobin	2	98	0		
5	azoxystrobin	10	100	96		
0	tetraconazole	0,08	0		0	
0	tetraconazole	0,4	21		0	
0	tetraconazole	2	93		27	
0	tetraconazole	10	97		99	
2	tetraconazole	0,08	0	0	0	27
2	tetraconazole	0,4	0	21	9	27
2	tetraconazole	2	55	93	60	47
2	tetraconazole	10	99	97	100	99
5	tetraconazole	0,08	94	0	74	68
5	tetraconazole	0,4	94	21	74	68
5	tetraconazole	2	97	93	98	77
5	tetraconazole	10	100	97	100	100
0	pyraclostrobin	0,08	0		9	
0	pyraclostrobin	0,4	0		80	
0	pyraclostrobin	2	0		98	
0	pyraclostrobin	10	93		100	
2	pyraclostrobin	0,08	0	0	27	34
2	pyraclostrobin	0,4	0	0	85	85
2	pyraclostrobin	2	58	0	97	99
2	pyraclostrobin	10	94	93	100	100
5	pyraclostrobin	0,08	97	0	74	71
5	pyraclostrobin	0,4	96	0	94	94

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K4		Thử nghiệm L4	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
5	pyraclostrobin	2	98	0	100	99
5	pyraclostrobin	10	99	93	100	100
0	prothioconazole	0,08	0		0	
0	prothioconazole	0,4	0		0	
0	prothioconazole	2	0		9	
0	prothioconazole	10	93		9	
2	prothioconazole	0,08	0	0	0	27
2	prothioconazole	0,4	0	0	0	27
2	prothioconazole	2	47	0	0	34
2	prothioconazole	10	98	93	27	34
5	prothioconazole	0,08	96	0	80	68
5	prothioconazole	0,4	96	0	74	68
5	prothioconazole	2	97	0	55	71
5	prothioconazole	10	98	93	74	71
0	picoxystrobin	0,08	0		0	
0	picoxystrobin	0,4	0		9	
0	picoxystrobin	2	0		82	
0	picoxystrobin	10	99		100	
2	picoxystrobin	0,08	0	0	0	27
2	picoxystrobin	0,4	0	0	27	34
2	picoxystrobin	2	42	0	85	87
2	picoxystrobin	10	100	99	100	100
5	picoxystrobin	0,08	93	0	60	68
5	picoxystrobin	0,4	95	0	80	71
5	picoxystrobin	2	96	0	90	94
5	picoxystrobin	10	100	99	100	100
0	epoxiconazole	0,08	0		0	
0	epoxiconazole	0,4	90		93	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K4		Thử nghiệm L4	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	epoxiconazole	2	98		99	
0	epoxiconazole	10	100		100	
2	epoxiconazole	0,08	0	0	55	27
2	epoxiconazole	0,4	29	90	97	95
2	epoxiconazole	2	99	98	99	99
2	epoxiconazole	10	100	100	100	100
5	epoxiconazole	0,08	93	0	91	68
5	epoxiconazole	0,4	98	90	100	98
5	epoxiconazole	2	100	98	100	100
5	epoxiconazole	10	100	100	100	100

Bảng F

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Quinoxifen, Cyproconazole, Penthiopyrad, Isopyrazam, Difenoconazole, Azoxystrobin hoặc Proquinazid để phòng trừ bệnh phấn trắng cây lúa mì hoặc bệnh gỉ sắt ở lá

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K5		Thử nghiệm L5	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0		0	
1	không có mặt	0	0		18	
2	không có mặt	0	0		27	
5	không có mặt	0	0		55	
10	không có mặt	0	100		82	
0	quinoxifen	0,016	21		—	
0	quinoxifen	0,08	29		—	
0	quinoxifen	0,4	64		—	
0	quinoxifen	2	93		—	
2	quinoxifen	0,016	90	21	—	
2	quinoxifen	0,08	87	29	—	
2	quinoxifen	0,4	90	64	—	
2	quinoxifen	2	99	93	—	
5	quinoxifen	0,016	99	21	—	
5	quinoxifen	0,08	100	29	—	
5	quinoxifen	0,4	100	64	—	
5	quinoxifen	2	100	93	—	
0	cyproconazole	0,016	64		27	
0	cyproconazole	0,08	64		80	
0	cyproconazole	0,4	79		92	
0	cyproconazole	2	96		100	
2	cyproconazole	0,016	42	64	55	47
2	cyproconazole	0,08	64	64	74	85

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K5		Thử nghiệm L5	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
2	cyproconazole	0,4	96	79	93	94
2	cyproconazole	2	100	96	100	100
5	cyproconazole	0,016	100	64	68	67
5	cyproconazole	0,08	99	64	97	91
5	cyproconazole	0,4	100	79	98	96
5	cyproconazole	2	100	96	100	100
0	penthiopyrad	0,016	—		9	
0	penthiopyrad	0,08	—		55	
0	penthiopyrad	0,4	—		68	
0	penthiopyrad	2	—		99	
2	penthiopyrad	0,016	—		55	34
2	penthiopyrad	0,08	—		68	67
2	penthiopyrad	0,4	—		68	77
2	penthiopyrad	2	—		99	99
5	penthiopyrad	0,016	—		74	59
5	penthiopyrad	0,08	—		80	79
5	penthiopyrad	0,4	—		88	85
5	penthiopyrad	2	—		100	100
0	isopyrazam	0,016	—		68	
0	isopyrazam	0,08	—		89	
0	isopyrazam	0,4	—		100	
0	isopyrazam	2	—		100	
2	isopyrazam	0,016	—		74	77
2	isopyrazam	0,08	—		88	92
2	isopyrazam	0,4	—		100	100
2	isopyrazam	2	—		100	100
5	isopyrazam	0,016	—		88	85
5	isopyrazam	0,08	—		99	95

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K5		Thử nghiệm L5	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
5	isopyrazam	0,4	—		100	100
5	isopyrazam	2	—		100	100
0	difenoconazole	0,016	—		68	
0	difenoconazole	0,08	—		68	
0	difenoconazole	0,4	—		92	
0	difenoconazole	2	—		100	
2	difenoconazole	0,016	—		27	77
2	difenoconazole	0,08	—		41	77
2	difenoconazole	0,4	—		99	94
2	difenoconazole	2	—		100	100
5	difenoconazole	0,016	—		74	85
5	difenoconazole	0,08	—		80	85
5	difenoconazole	0,4	—		100	96
5	difenoconazole	2	—		100	100
0	azoxystrobin	0,016	—		0	
0	azoxystrobin	0,08	—		68	
0	azoxystrobin	0,4	—		100	
0	azoxystrobin	2	—		100	
2	azoxystrobin	0,016	—		27	27
2	azoxystrobin	0,08	—		74	77
2	azoxystrobin	0,4	—		100	100
2	azoxystrobin	2	—		100	100
5	azoxystrobin	0,016	—		74	55
5	azoxystrobin	0,08	—		97	85
5	azoxystrobin	0,4	—		100	100
5	azoxystrobin	2	—		100	100
0	proquinazid	0,016	0		—	
0	proquinazid	0,08	0		—	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm K5		Thử nghiệm L5	
			Thu được	Dự tính	Thu được	Dự tính
0	proquinazid	0,4	0		—	
0	proquinazid	2	71		—	
2	proquinazid	0,016	0	0	—	
2	proquinazid	0,08	0	0	—	
2	proquinazid	0,4	0	0	—	
2	proquinazid	2	87	71	—	
5	proquinazid	0,016	87	0	—	
5	proquinazid	0,08	89	0	—	
5	proquinazid	0,4	93	0	—	
5	proquinazid	2	98	71	—	

Bảng G

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Probenazole, Mancozeb, Iprodione, Boscalid, đồng hydroxit, Cymoxanil hoặc Chlorothalonil để phòng trừ bệnh đốm lá lúa mỳ

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M1	
			Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0	
0,01	không có mặt	0	0	
0,1	không có mặt	0	0	
1	không có mặt	0	86	
10	không có mặt	0	100	
0	probenazole	10	0	
0	probenazole	40	0	
0	probenazole	200	0	
0,1	probenazole	10	0	0
0,1	probenazole	40	0	0
0,1	probenazole	200	25	0
1	probenazole	10	87	86
1	probenazole	40	94	86
1	probenazole	200	87	86
0	mancozeb	10	0	
0	mancozeb	40	55	
0	mancozeb	200	91	
0,1	mancozeb	10	0	0
0,1	mancozeb	40	63	55
0,1	mancozeb	200	96	91
1	mancozeb	10	81	86
1	mancozeb	40	98	94
1	mancozeb	200	100	99
0	iprodione	10	0	
0	iprodione	40	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M1	
			Thu được	Dự tính
0	iprodione	200	0	
0,1	iprodione	10	0	0
0,1	iprodione	40	0	0
0,1	iprodione	200	22	0
1	iprodione	10	88	86
1	iprodione	40	91	86
1	iprodione	200	98	86
0	boscalid	10	77	
0	boscalid	40	90	
0	boscalid	200	99	
0,1	boscalid	10	72	77
0,1	boscalid	40	98	90
0,1	boscalid	200	98	99
1	boscalid	10	99	97
1	boscalid	40	100	99
1	boscalid	200	100	100
0	đồng hydroxit	10	0	
0	đồng hydroxit	40	45	
0	đồng hydroxit	200	77	
0,1	đồng hydroxit	10	0	0
0,1	đồng hydroxit	40	25	45
0,1	đồng hydroxit	200	87	77
1	đồng hydroxit	10	72	86
1	đồng hydroxit	40	93	92
1	đồng hydroxit	200	99	97
0	cymoxanil	10	0	
0	cymoxanil	40	0	
0	cymoxanil	200	0	
0,1	cymoxanil	10	0	0

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M1	
			Thu được	Dự tính
0,1	cymoxanil	40	0	0
0,1	cymoxanil	200	0	0
1	cymoxanil	10	96	86
1	cymoxanil	40	85	86
1	cymoxanil	200	96	86
0	chlorothalonil	10	0	
0	chlorothalonil	40	42	
0	chlorothalonil	200	99	
0,1	chlorothalonil	10	0	0
0,1	chlorothalonil	40	75	42
0,1	chlorothalonil	200	98	99
1	chlorothalonil	10	72	86
1	chlorothalonil	40	80	92
1	chlorothalonil	200	99	100

Bảng H

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với BAS600, Isopyrazam, Penthiopyrad, Bixafen hoặc Cyproconazole để phòng trừ bệnh đốm lá lúa mì

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M2	
			Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0	
0,01	không có mặt	0	0	
0,1	không có mặt	0	0	
1	không có mặt	0	95	
10	không có mặt	0	100	
0	BAS600	0,016	0	
0	BAS600	0,08	0	
0	BAS600	0,4	93	
0	BAS600	2	100	
0,1	BAS600	0,02	0	0
0,1	BAS600	0,08	38	0
0,1	BAS600	0,40	96	93
0,1	BAS600	2	100	100
1	BAS600	0,02	65	95
1	BAS600	0,08	85	95
1	BAS600	0,40	97	100
1	BAS600	2	99	100
0	isopyrazam	0,08	0	
0	isopyrazam	0,40	77	
0	isopyrazam	2	93	
0	isopyrazam	10	100	
0,1	isopyrazam	0,08	0	0
0,1	isopyrazam	0,40	72	77
0,1	isopyrazam	2	—	
0,1	isopyrazam	10	—	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M2	
			Thu được	Dự tính
1	isoprazam	0,08	–	
1	isoprazam	0,40	80	99
1	isoprazam	2	–	
1	isoprazam	10	100	100
0	penthiopyrad	0,08	0	
0	penthiopyrad	0,40	0	
0	penthiopyrad	2	–	
0	penthiopyrad	10	–	
0,1	penthiopyrad	0,08	0	0
0,1	penthiopyrad	0,40	17	0
0,1	penthiopyrad	2	–	
0,1	penthiopyrad	10	99	
1	penthiopyrad	0,08	83	95
1	penthiopyrad	0,40	73	95
1	penthiopyrad	2	–	
1	penthiopyrad	10	99	
0	bixafen	0,08	0	
0	bixafen	0,40	33	
0	bixafen	2	89	
0	bixafen	10	–	
0,1	bixafen	0,08	0	0
0,1	bixafen	0,40	33	33
0,1	bixafen	2	83	89
0,1	bixafen	10	100	
1	bixafen	0,08	–	
1	bixafen	0,4	85	97
1	bixafen	2	–	
1	bixafen	10	–	
0	cyproconazole	0,4	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M2	
			Thu được	Dự tính
0	cyproconazole	2	0	
0	cyproconazole	10	0	
0	cyproconazole	40	98	
0,1	cyproconazole	0,4	0	0
0,1	cyproconazole	2	0	0
0,1	cyproconazole	10	0	0
0,1	cyproconazole	40	98	98
1	cyproconazole	0,4	73	95
1	cyproconazole	2	63	95
1	cyproconazole	10	97	95
1	cyproconazole	40	100	100

Bảng I

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Fludioxonil, Epoxiconazole, Prothioconazole, Difenoconazole hoặc Fenpropimorph để phòng trừ bệnh đốm lá lúa mỳ

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M3	
			Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0	
0,01	không có mặt	0	0	
0,1	không có mặt	0	0	
1	không có mặt	0	52	
10	không có mặt	0	100	
0	fludioxonil	0,08	0	
0	fludioxonil	0,4	0	
0	fludioxonil	2	37	
0	fludioxonil	10	67	
0,1	fludioxonil	0,08	0	0
0,1	fludioxonil	0,4	0	0
0,1	fludioxonil	2	30	37
0,1	fludioxonil	10	57	67
1	fludioxonil	0,08	83	52
1	fludioxonil	0,4	45	52
1	fludioxonil	2	68	69
1	fludioxonil	10	78	84
0	epoxiconazole	0,4	0	
0	epoxiconazole	2	0	
0	epoxiconazole	10	76	
0	epoxiconazole	40	100	
0,1	epoxiconazole	0,4	0	0
0,1	epoxiconazole	2	0	0
0,1	epoxiconazole	10	75	76
0,1	epoxiconazole	40	98	100

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M3	
			Thu được	Dự tính
1	epoxiconazole	0,4	78	52
1	epoxiconazole	2	78	52
1	epoxiconazole	10	97	89
1	epoxiconazole	40	100	100
0	prothioconazole	0,4	0	
0	prothioconazole	2	0	
0	prothioconazole	10	18	
0	prothioconazole	40	85	
0,1	prothioconazole	0,4	0	0
0,1	prothioconazole	2	0	0
0,1	prothioconazole	10	25	18
0,1	prothioconazole	40	—	
1	prothioconazole	0,4	48	52
1	prothioconazole	2	25	52
1	prothioconazole	10	73	61
1	prothioconazole	40	88	93
0	difenoconazole	0,4	0	
0	difenoconazole	2	0	
0	difenoconazole	10	52	
0	difenoconazole	40	95	
0,1	difenoconazole	0,4	0	0
0,1	difenoconazole	2	0	0
0,1	difenoconazole	10	57	52
0,1	difenoconazole	40	98	95
1	difenoconazole	0,4	78	52
1	difenoconazole	2	50	52
1	difenoconazole	10	88	77
1	difenoconazole	40	100	97
0	fenpropimorph	2	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M3	
			Thu được	Dự tính
0	fenpropimorph	10	0	
0	fenpropimorph	40	0	
0	fenpropimorph	200	0	
0,1	fenpropimorph	2	0	0
0,1	fenpropimorph	10	0	0
0,1	fenpropimorph	40	0	0
0,1	fenpropimorph	200	0	0
1	fenpropimorph	2	85	52
1	fenpropimorph	10	75	52
1	fenpropimorph	40	86	52
1	fenpropimorph	200	98	52

Bảng J

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Pyraclostrobin, Tricyclazole, Fluazinam, Dimethomorph, Iprovalicarb, Metalaxyl-M, Folpet hoặc Myclobutanil để phòng trừ bệnh đốm lá lúa mì

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M4	
			Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0	
0,01	không có mặt	0	0	
0,1	không có mặt	0	23	
1	không có mặt	0	66	
10	không có mặt	0	100	
0	pyraclostrobin	10	0	
0	pyraclostrobin	40	26	
0	pyraclostrobin	200	93	
0,1	pyraclostrobin	10	0	23
0,1	pyraclostrobin	40	32	43
0,1	pyraclostrobin	200	91	94
1	pyraclostrobin	10	79	66
1	pyraclostrobin	40	90	75
1	pyraclostrobin	200	97	98
0	tricyclazole	10	0	
0	tricyclazole	40	0	
0	tricyclazole	200	0	
0,1	tricyclazole	10	0	23
0,1	tricyclazole	40	0	23
0,1	tricyclazole	200	0	23
1	tricyclazole	10	74	66
1	tricyclazole	40	93	66
1	tricyclazole	200	74	66
0	fluazinam	10	0	
0	fluazinam	40	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M4	
			Thu được	Dự tính
0	fluazinam	200	93	
0,1	fluazinam	10	13	23
0,1	fluazinam	40	60	23
0,1	fluazinam	200	85	95
1	fluazinam	10	76	66
1	fluazinam	40	97	66
1	fluazinam	200	100	98
0	dimethomorph	10	0	
0	dimethomorph	40	0	
0	dimethomorph	200	0	
0,1	dimethomorph	10	0	23
0,1	dimethomorph	40	0	23
0,1	dimethomorph	200	16	23
1	dimethomorph	10	93	66
1	dimethomorph	40	91	66
1	dimethomorph	200	0	66
0	iprovalicarb	10	0	
0	iprovalicarb	40	0	
0	iprovalicarb	200	0	
0,1	iprovalicarb	10	0	23
0,1	iprovalicarb	40	23	23
0,1	iprovalicarb	200	53	23
1	iprovalicarb	10	81	66
1	iprovalicarb	40	96	66
1	iprovalicarb	200	96	66
0	metalaxyl-M	10	0	
0	metalaxyl-M	40	0	
0	metalaxyl-M	200	0	
0,1	metalaxyl-M	10	0	23

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M4	
			Thu được	Dự tính
0,1	metalaxyl-M	40	0	23
0,1	metalaxyl-M	200	32	23
1	metalaxyl-M	10	86	66
1	metalaxyl-M	40	96	66
1	metalaxyl-M	200	96	66
0	folpet	10	0	
0	folpet	40	73	
0	folpet	200	91	
0,1	folpet	10	32	23
0,1	folpet	40	86	79
0,1	folpet	200	93	93
1	folpet	10	91	66
1	folpet	40	91	91
1	folpet	200	98	97
0	myclobutanil	10	0	
0	myclobutanil	40	44	
0	myclobutanil	200	74	
0,1	myclobutanil	10	13	23
0,1	myclobutanil	40	0	57
0,1	myclobutanil	200	61	80
1	myclobutanil	10	16	66
1	myclobutanil	40	91	81
1	myclobutanil	200	74	91

Bảng K

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và ở dạng hỗn hợp với Quinoxifen, Azoxystrobin, Picoxystrobin, Tetraconazole, Spiroxamin hoặc Proquinazid để phòng trừ bệnh đốm lá lúa mỳ

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M5	
			Thu được	Dự tính
0	không có mặt	0	0	
0,01	không có mặt	0	0	
0,1	không có mặt	0	3	
1	không có mặt	0	90	
10	không có mặt	0	100	
0	quinoxifen	10	0	
0	quinoxifen	40	0	
0	quinoxifen	200	8	
0,1	quinoxifen	10	0	3
0,1	quinoxifen	40	0	3
0,1	quinoxifen	200	0	11
1	quinoxifen	10	95	90
1	quinoxifen	40	99	90
1	quinoxifen	200	99	91
0	azoxystrobin	10	0	
0	azoxystrobin	40	20	
0	azoxystrobin	200	50	
0,1	azoxystrobin	10	0	3
0,1	azoxystrobin	40	3	23
0,1	azoxystrobin	200	61	52
1	azoxystrobin	10	90	90
1	azoxystrobin	40	94	92
1	azoxystrobin	200	93	95
0	picoxystrobin	10	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M5	
			Thu được	Dự tính
0	picoxystrobin	40	0	
0	picoxystrobin	200	0	
0,1	picoxystrobin	10	0	3
0,1	picoxystrobin	40	0	3
0,1	picoxystrobin	200	0	3
1	picoxystrobin	10	79	90
1	picoxystrobin	40	70	90
1	picoxystrobin	200	85	90
0	tetraconazole	10	0	
0	tetraconazole	40	7	
0	tetraconazole	200	99	
0,1	tetraconazole	10	13	3
0,1	tetraconazole	40	60	10
0,1	tetraconazole	200	99	99
1	tetraconazole	10	87	90
1	tetraconazole	40	99	91
1	tetraconazole	200	100	100
0	spiroxamin	10	0	
0	spiroxamin	40	3	
0	spiroxamin	200	0	
0,1	spiroxamin	10	0	3
0,1	spiroxamin	40	0	7
0,1	spiroxamin	200	7	3
1	spiroxamin	10	88	90
1	spiroxamin	40	85	90
1	spiroxamin	200	100	90
0	proquinazid	10	0	
0	proquinazid	40	0	

Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp chất 81	Hợp phần (b)	Tỷ lệ dùng (ppm) của hợp phần (b)	Thử nghiệm M5	
			Thu được	Dự tính
0	proquinazid	200	0	
0,1	proquinazid	10	0	3
0,1	proquinazid	40	0	3
0,1	proquinazid	200	0	3
1	proquinazid	10	22	90
1	proquinazid	40	55	90
1	proquinazid	200	25	90

Các Bảng từ B đến K thể hiện các chế phẩm theo sáng chế chứa hỗn hợp của Hợp chất có công thức 1 đại diện với nhiều hợp chất hợp phần (b) cho thấy rằng trong một số trường hợp, có tác dụng hiệp đồng trong việc phòng trừ bệnh phấn trắng cây lúa mì, bệnh gỉ sắt lá cây, và bệnh đốm lá. Vì mẫu đối chứng không thể vượt quá giá trị 100%, không phải luôn nhận thấy sự tăng hoạt tính cao hơn hoạt tính diệt nấm dự tính trong hỗn hợp nhưng có nhiều khả năng nhận thấy hơn khi thành phần hoạt chất riêng rẽ đơn lẻ ở tỷ lệ dùng mang lại hiệu quả phòng trừ nhỏ hơn đáng kể 100%. Tác dụng hiệp đồng có thể không biểu hiện rõ ràng với tỷ lệ dùng thấp khi mà hợp phần hoạt chất đơn lẻ có hoạt tính thấp. Tuy nhiên, trong một số trường hợp nhận thấy hoạt tính tăng lên cho kết hợp mà trong đó từng hoạt chất dùng đơn lẻ ở cùng tỷ lệ dùng có ít hoặc không có hoạt tính. Như đã nêu trên, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ bệnh phấn trắng (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*), bệnh gỉ sắt lá cây (*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*), và bệnh đốm lá lúa mì (*Septoria tritici*).

Các thử nghiệm N1 và N2

Các thử nghiệm N1 và N2 liên quan đến việc đánh giá hỗn hợp của Hợp chất 81 lần lượt với 2-[(3-bromo-8-metyl-6-quinolinyl)oxy]-*N*-(1,1-đimetyl-2-propyn-1-yl)-2-(methylthio)axetamit (Hợp chất A1) và 2-[(3-bromo-6-quinolinyl)oxy]-*N*-(1,1-đimetyletyl)butanamit (Hợp chất A2) để ức chế sự phát triển của *Septoria tritici* (tác

nhân gây bệnh đốm lá lúa mì). Phương pháp chung để điều chế chế phẩm thử nghiệm là như sau. Hợp chất 81 (các thử nghiệm N1 và N2), Hợp chất A1 (Thử nghiệm N1) và Hợp chất A2 (Thử nghiệm N2) được thu nhận dưới dạng chất tinh khiết cấp kỹ thuật không được chế hóa. Các hợp chất thử nghiệm không được chế hóa trước hết được hoà tan trong DMSO ở nồng độ thích hợp để tạo ra nồng độ mong muốn (theo μM) sau khi trộn với môi trường sinh trưởng của nấm trong các lỗ của đĩa 96 lỗ chứa 200 μl môi trường sinh trưởng của nấm cho mỗi lỗ. Khoảng nồng độ hợp chất được lựa chọn để thu được khoảng hoạt tính ức chế từ 0 đến gần 100% để nhận diện tác động hiệp đồng bất kỳ khi *Septoria tritici* được xử lý bằng các hợp chất được cho vào kết hợp. Dung dịch DMSO của các hợp chất thử nghiệm được cho vào các lỗ trước khi bổ sung môi trường sinh trưởng của nấm.

Môi trường rắn sinh trưởng của nấm được điều chế bằng cách tạo ra hỗn hợp nước chứa đikali hydro phosphat (3,0 g/l), kali dihydro phosphat (4,0 g/l), natri clorua (0,5 g/l), amoni clorua (1,0 g/l), magie sulfat heptahydrat (0,2 g) và canxi clorua dihydrat (0,01 g/l), còn chứa 1 ml/l dung dịch nguyên tố với lượng vết (mangan sulfat hydrat (0,1 mg/ml), kẽm sulfat heptahydrat (0,2 mg/ml), đồng(II) sulfat pentahydrat (0,2 mg/ml), sắt(II) sulfat heptahydrat (0,2 mg/ml), natri molybđat dihydrat (0,1 mg/ml), coban(II) sulfat heptahydrat (0,06 mg/ml), axit boric (0,08 mg/ml)), và được bổ sung 50 $\mu\text{L/L}$ dung dịch gốc biotin (0,1 mg/ml). Điều chỉnh độ pH đến 6,8 bằng dung dịch nước natri cacbonat 1 M. Hỗn hợp này được bổ sung thêm 1 g/L dịch chiết nấm men, và cho gồm GELRITE gellan (Kelco) (4 g/l) vào. Cho đủ nước vào đến thể tích là 90% thể tích cuối (ví dụ, thể tích 900 ml để điều chế 1 lít môi trường sinh trưởng của nấm). Hỗn hợp này được khử trùng. Khi làm nguội xuống 60 °C, cho 100 ml/l dung dịch dextroza trong nước (10 g/l), 500 $\mu\text{L/L}$ dung dịch ampicilin trong nước (100 mg/ml) và 500 $\mu\text{L/L}$ dung dịch rifampicin (10 mg/ml trong DMSO) vào để tạo ra thể tích cuối của môi trường sinh trưởng của nấm, sau đó môi trường này được phân tán trong khi vẫn còn ấm bằng cách sử dụng pipet microlit vào các lỗ của đĩa 96 lỗ. Môi trường sinh trưởng của nấm đã được đưa vào trong mỗi lỗ được khuấy bằng cách

sử dụng đầu của pipet phân tán để phối trộn môi trường này với dung dịch DMSO chứa hợp chất thử nghiệm.

Sau khi môi trường sinh trưởng của nấm trong các lỗ này nguội xuống nhiệt độ trong phòng và hoá rắn, bề mặt trên của môi trường sinh trưởng trong mỗi lỗ được cấy 20 μL huyền phù nấm chứa 8×10^4 tế bào. Sau thời gian 2 h làm khô trong nắp đáy vô trùng, các đĩa được đưa vào tủ ẩm tối ở nhiệt độ 25 °C trong thời gian 5 ngày.

Đánh giá sự phát triển của nấm trên đầu đọc đĩa được thiết lập để đo sự hấp thụ ở ánh sáng 600 nm. Phần trăm sự ức chế phát triển thu được (Thu được.) trong các thử nghiệm N1 và N2, cũng như phần trăm ức chế sự phát triển dự tính (Dự tính.) được tính toán bằng cách sử dụng phương trình Colby, lần lượt được nêu ra trong các Bảng L và M.

Bảng L

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và trong hỗn hợp với Hợp chất A1 là Hợp phần (b) để phòng trừ *Septoria tritici*

Tỷ lệ dùng của hợp chất 81 (μM)	Tỷ lệ dùng của hợp chất A1 (μM)	% ức chế	
		Thu được	Dự tính
0,2	0	98,0	
0,04	0	93,5	
0,008	0	10,0	
0,0016	0	5,0	
0,00032	0	9,0	
0	0	0	
0	0,2	98,0	
0	0,04	97	
0	0,008	14,5	
0	0,0016	5	
0	0,00032	3	
0	0	0	0
0,2	0,2	98	98
0,2	0,04	98	98
0,2	0,008	98	98
0,2	0,0016	98	98
0,2	0,00032	98	98
0,04	0,2	98	99,0
0,04	0,04	98	99,0
0,04	0,008	98	96,0
0,04	0,0016	94,2	94,0
0,04	0,00032	92	96,0
0,008	0,2	98,0	99,0
0,008	0,04	97,0	99,0
0,008	0,008	62,0	22,0
0,008	0,0016	6,0	14,0
0,008	0,00032	5,0	13,0
0,016	0,2	98,0	98,0
0,016	0,04	97,0	96,0
0,016	0,008	32,0	18,0
0,016	0,0016	5,0	10,0
0,016	0,00032	9,0	8,0

Tỷ lệ dùng của hợp chất 81 (μM)	Tỷ lệ dùng của hợp chất A1 (μM)	% ức chế	
		Thu được	Dự tính
0,0032	0,2	98,0	97,0
0,0032	0,04	94,0	96,0
0,0032	0,008	8,0	22,0
0,0032	0,0016	8,0	14,0
0,0032	0,00032	6,0	12,0

Bảng M

Hiệu quả thu được và dự tính của hợp chất 81 khi dùng đơn lẻ và trong hỗn hợp với
Hợp chất A2 là Hợp phần (b) để phòng trừ *Septoria tritici*

Tỷ lệ dùng của hợp chất 81 (μM)	Tỷ lệ dùng của hợp chất A2 (μM)	% ức chế	
		Thu được	Dự tính
0,2	0	96,0	
0,04	0	93,5	
0,008	0	29,0	
0,0016	0	0,0	
0,00032	0	0,0	
0	0	0	
0	20	96,0	
0	4	95,0	
0	0,8	11,5	
0	0,16	6,5	
0	0,032	0,0	
0	0	0	
0,2	20	96	100
0,2	4	96	100
0,2	0,8	96	96
0,2	0,16	96	96
0,2	0,032	96	96
0,04	20	96,0	100
0,04	4	96,0	100
0,04	0,8	96,0	94,2
0,04	0,16	95,5	93,9
0,04	0,032	95,0	93,5
0,008	20	96,0	97,2

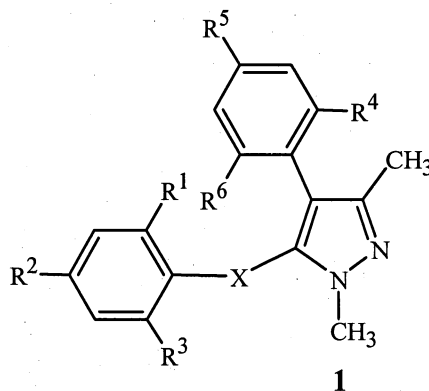
Tỷ lệ dùng của hợp chất 81 (μM)	Tỷ lệ dùng của hợp chất A2 (μM)	% ức chế	
		Thu được	Dự tính
0,008	4	96,0	96,5
0,008	0,8	68,0	37,2
0,008	0,16	0,0	33,6
0,008	0,032	0,0	29,0
0,016	20	96,0	96,0
0,016	4	96,0	95,0
0,016	0,8	46,5	11,5
0,016	0,16	6,5	6,5
0,016	0,032	0,0	0,0
0,0032	20	96,0	96,0
0,0032	4	95,0	95,0
0,0032	0,8	13,0	11,5
0,0032	0,16	24,5	6,5
0,0032	0,032	1,5	0,0

Các kết quả thu được và dự tính từ các hỗn hợp của Hợp chất 81 với Hợp chất A1 trong thử nghiệm N1 được thể hiện trong Bảng L thể hiện hoạt tính cao hơn dự tính (tức là hiệp đồng) ở tỷ lệ dùng trong đó Hợp chất 81 và Hợp chất A1 khi dùng riêng rẽ tạo ra mức ức chế nhỏ hơn nhiều 100% (để cho tăng biểu hiện hiệp đồng trong việc ức chế) mà còn cả khi mức tỷ lệ dùng không được giảm nhiều so với tỷ lệ dùng tạo ra mức ức chế cao của các hợp chất 81 và Hợp chất A1 khi dùng riêng rẽ (ví dụ, tỷ lệ dùng là 0,008 hoặc 0,016 μM của hợp chất 81 và tỷ lệ dùng 0,008 μM của hợp chất A1). Tương tự, các kết quả thu được và dự tính từ các hỗn hợp của Hợp chất 81 với Hợp chất A2 trong thử nghiệm N2 được thể hiện trong Bảng M thể hiện hoạt tính cao hơn dự tính ở tỷ lệ dùng trong đó Hợp chất 81 và Hợp chất A2 riêng rẽ tạo ra mức ức chế nhỏ hơn nhiều 100% mà còn cả khi mức tỷ lệ dùng không được giảm nhiều so với tỷ lệ dùng tạo ra mức ức chế cao của các hợp chất 81 và Hợp chất A2 riêng rẽ (ví dụ, tỷ lệ dùng 0,008 hoặc 0,016 μM của hợp chất 81 và tỷ lệ dùng 0,8 μM của hợp chất A2).

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chế phẩm diệt nấm chứa:

(a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, *N*-oxit, và muối của chúng:



trong đó:

X là NH;

R¹ là halogen;

R² là H;

R³ là halogen;

R⁴ là halogen;

R⁵ là H, xyano, halogen hoặc C₁–C₂ alkoxy; và

R⁶ là H hoặc halogen; và

(b) ít nhất một hợp chất diệt nấm bổ sung;

với điều kiện là khi R¹ là F, thì R³ là Cl, và khi R¹ là Cl, thì R³ là F.

2. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) chứa hợp chất có công thức 1 hoặc muối của chúng, trong đó trong công thức 1, nhiều nhất, chỉ một trong số R⁵ và R⁶ là H.

3. Chế phẩm theo điểm 2, trong đó trong công thức 1:

R^1 là F, Cl hoặc Br;

R^2 là H;

R^3 là F hoặc Cl;

R^4 là F, Cl hoặc Br;

R^5 là H, xyano, F, Cl hoặc metoxy; và

R^6 là H hoặc F.

4. Chế phẩm theo điểm 3, trong đó trong công thức 1:

R^3 là F; và

R^5 là xyano, F, Cl hoặc metoxy.

5. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) chứa hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm:

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin,

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-

5-amin,

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-

5-amin,

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-

amin,

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2,4-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin,

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin,

N-(2-clo-6-flophenyl)-4-(2-flo-4-methoxyphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-

amin,

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-flo-4-methoxyphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-

5-amin,

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-methoxyphenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-

5-amin, và

N-(2-clo-6-flophenyl)-4-(2,4-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.

6. Chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ nhóm bao gồm:

- (b1) các thuốc diệt nấm metyl benzimidazole carbamat;
- (b2) các thuốc diệt nấm đicarboximit;
- (b3) các thuốc diệt nấm là chất ức chế khử metyl;
- (b4) các thuốc diệt nấm phenylamit;
- (b5) các thuốc diệt nấm amin/morpholin;
- (b6) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp phospholipit;
- (b7) các thuốc diệt nấm carboxamit;
- (b8) các thuốc diệt nấm hydroxy(2-amino-)pyrimidin;
- (b9) các thuốc diệt nấm anilinopyrimidin;
- (b10) các thuốc diệt nấm *N*-phenyl carbamat;
- (b11) các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon;
- (b12) các thuốc diệt nấm phenylpyrol;
- (b13) các thuốc diệt nấm quinolin;
- (b14) các thuốc diệt nấm là chất ức chế quá trình peroxy hóa của lipit;
- (b15) các thuốc diệt nấm chất ức chế sinh tổng hợp melanin-reductaza;
- (b16) các thuốc diệt nấm là chất ức chế sinh tổng hợp melanin-dehydrataza;
- (b17) các thuốc diệt nấm hydroxyanilit;
- (b18) các thuốc diệt nấm là chất ức chế squalen-epoxidaza;
- (b19) các thuốc diệt nấm polyoxin;
- (b20) các thuốc diệt nấm phenylure;
- (b21) các thuốc diệt nấm là chất ức chế ở vị trí bên trong quinon;

- (b22) các thuốc diệt nấm benzamide;
- (b23) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh là axit enopyranuronic;
- (b24) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh hexopyranosyl;
- (b25) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế tổng hợp protein;
- (b26) các thuốc diệt nấm glucopyranosyl là chất kháng sinh: ức chế sinh tổng hợp trehalaza và inositol;
- (b27) các thuốc diệt nấm xyanoaxetamitoxim;
- (b28) các thuốc diệt nấm carbamat;
- (b29) các thuốc diệt nấm làm mất kết hợp quá trình phosphoryl hóa có tính oxy hóa;
- (b30) các thuốc diệt nấm là hợp chất thiếc hữu cơ;
- (b31) các thuốc diệt nấm là axit carboxylic;
- (b32) các thuốc diệt nấm dị vòng thơm;
- (b33) các thuốc diệt nấm phosphonat;
- (b34) các thuốc diệt nấm axit phtalamic;
- (b35) các thuốc diệt nấm benzotriazin;
- (b36) các thuốc diệt nấm benzen-sulfonamit;
- (b37) các thuốc diệt nấm pyridazinon;
- (b38) các thuốc diệt nấm thiophen-carboxamit;
- (b39) các thuốc diệt nấm pyrimidinamit;
- (b40) các thuốc diệt nấm amit của axit carboxylic;
- (b41) các thuốc diệt nấm có tính kháng sinh tetracyclin;
- (b42) các thuốc diệt nấm thiocarbamat;

(b43) các thuốc diệt nấm benzamide;

(b44) các thuốc diệt nấm cảm ứng cơ chế phòng vệ của thực vật chủ;

(b45) các thuốc diệt nấm có hoạt tính tiếp xúc nhiều vị trí;

(b46) các hợp chất diệt nấm không phải là các hợp chất diệt nấm hợp phần (a) và hợp phần từ (b1) đến (b45); và muối của các hợp chất từ (b1) đến (b46).

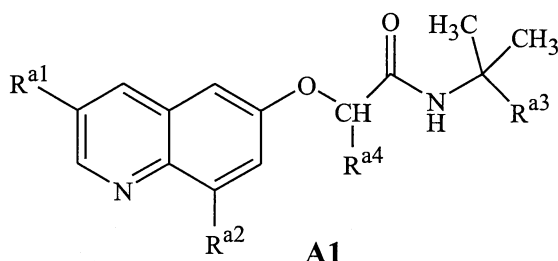
7. Chế phẩm theo điểm 6, trong đó hợp phần (b) chứa ít nhất một hợp chất diệt nấm từ một trong số hai nhóm khác nhau được chọn từ (b1) đến (b46).

8. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (b) chứa ít nhất một hợp chất được chọn từ acibenzolar-*S*-metyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, bethoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-*S*, boscalid, bromuconazole, bupirimate, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, chlozolate, clotrimazole, các muối đồng, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, diflumetorim, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, diniconazole-M, dinocap, dithianon, dodemorph, dodine, edifenphos, enestroburin, epoxiconazole, ethaboxam, ethirimol, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin clorua, fentin hydroxit, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluopicolide, fluopyram, fluoroimide, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fosetyl-nhôm, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, hexaconazole, hymexazol, guazatine, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iodocarb, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl, metalaxyl-M, metconazole, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, mepanipyrim,

metrafenone, myclobutanil, naftifine, neo-asozin (sắt (III) metanarsonat), nuarimol, othilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, oxolinic axit, oxpoconazole, oxycarboxin, oxytetracyclin, penconazole, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, pefurazoate, axit phosphor và muối của chúng, phthalide, picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propamocarb-hydroclorua, propiconazole, propineb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributicarb, pyrifenox, pyrimethanil, pyriofenone, pyroquilon, pyrrolnitrin, quinomethionate, quinoxifen, quintozone, sedaxane, silthiofam, simeconazole, spiroxamin, streptomycin, sulfur, tebuconazole, tebufloquin, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate, thiophanate-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazoxide, tricyclazole, tridemorph, triflumizole, tricyclazole, trifloxystrobin, triforine, trimorphamide, triticonazole, uniconazole, validamycin, valifenalate, vinclozolin, zineb, ziram, zoxamide, *N*'-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-dimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit, 5-clo-6-(2,4,6-triflophenyl)-7-(4-metylpipeidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin, *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxypheyl]etyl]-3-metyl-2-[(metylsulfonyl)amino]butanamit, *N*-[2-[4-[[3-(4-clophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-metoxypheyl]etyl]-3-metyl-2-[(etylsulfonyl)amino]butanamit, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-on, 3-[5-(4-clophenyl)-2,3-dimetyl-3-isoxazolidinyl]pyridin, 4-flophenyl *N*-[1-[[[1-(4-xyanophenyl)etyl]sulfonyl]metyl]propyl]carbamate, *N*-[(xyclopropylmetoxy)amino][6-(điflometoxy)-2,3-điflophenyl]metylen]benzenaxetamit, α-(metoxyimino)-*N*-metyl-2-[[[1-[3-(triflometyl)phenyl]etoxyl]imino]metyl]benzenaxetamit, *N*'-[4-[4-clo-3-(triflometyl)phenoxy]-2,5-dimetylphenyl]-*N*-etyl-*N*-metylmetanimitamit, *N*-(4-clo-2-nitrophenyl)-*N*-etyl-4-metylbenzensulfonamit, 2-[[[3-(2,6-điclophenyl)-1-metyl-2-propen-1-yliden]amino]oxy]metyl]-α-(metoxyimino)-*N*-metylbenzenaxetamit, 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-metyletyl)-4-(2-metylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-on, 5-etyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidin-

7-ylamin, pentyl *N*-[4-[[[(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmetylen]amino]oxy]metyl]-2-thiazolyl]carbamat và pentyl *N*-[6-[[[(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmetylen]amino]oxy]metyl]-2-pyridinyl]carbamat.

9. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ các hợp chất có công thức A1 và muối của chúng:



trong đó:

R^{a1} là halogen, C_1 – C_4 alkoxy hoặc C_1 – C_4 alkynyl;

R^{a2} là H, halogen hoặc C_1 – C_4 alkyl;

R^{a3} là C_1 – C_{12} alkyl, C_1 – C_{12} haloalkyl, C_1 – C_{12} alkoxy, C_2 – C_{12} alkoxyalkyl, C_2 – C_{12} alkenyl, C_2 – C_{12} alkynyl, C_4 – C_{12} alkoxyalkenyl, C_4 – C_{12} alkoxyalkynyl, C_1 – C_{12} alkylthio hoặc C_2 – C_{12} alkylthioalkyl;

R^{a4} là metyl hoặc Y^{a1} – R^{a5} ;

R^{a5} là C_1 – C_2 alkyl; và

Y^{a1} là CH_2 , O hoặc S.

10. Chế phẩm diệt nấm chứa: (a) ít nhất một hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1 như được xác định ở điểm 1, *N*-oxit, và muối của chúng; và ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân phòng trừ loài gây hại không xương sống.

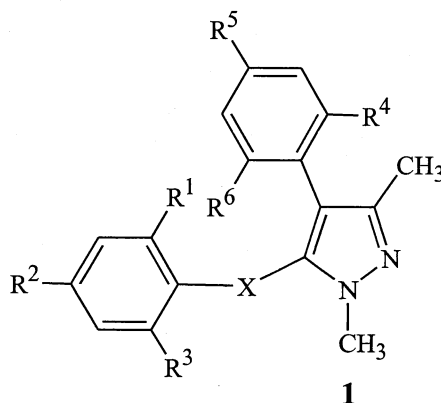
11. Chế phẩm diệt nấm chứa chế phẩm theo điểm 1 và ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng.

12. Phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa chế phẩm theo điểm 1 với một lượng hữu hiệu diệt nấm lên thực vật hoặc hạt giống thực vật.

13. Phương pháp bảo vệ thực vật khỏi bệnh phấn trắng bao gồm việc đưa lên thực vật chế phẩm theo điểm 1 với một lượng hữu hiệu diệt nấm trong đó hợp phần (b) bao gồm ít nhất một hợp chất diệt nấm được chọn từ (b11) các thuốc diệt nấm là chất ức chế vị trí gắn kết ngoài quinon.

14. Phương pháp bảo vệ thực vật khỏi bệnh *Septoria* bao gồm việc đưa lên thực vật chế phẩm theo điểm 9 với một lượng hữu hiệu diệt nấm.

15. Hợp chất có công thức 1 hoặc *N*-oxit hoặc muối của chúng,



trong đó:

X là NH;

R¹ là halogen;

R² là H;

R³ là halogen;

R⁴ là halogen;

R⁵ là H, xyano, halogen hoặc C₁–C₂ alkoxy; và

R⁶ là H hoặc halogen;

với điều kiện là khi R^1 là F, thì R^3 là Cl, và khi R^1 là Cl, thì R^3 là F.

16. Hợp chất theo điểm 15, trong đó:

R^3 là F hoặc Cl.

17. Hợp chất theo điểm 16, trong đó:

R^1 là Cl hoặc Br; và

R^3 là F.

18. Hợp chất theo điểm 15 được chọn từ nhóm bao gồm:

4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin,

4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin, và

N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.

19. Chế phẩm diệt nấm chứa: (1) hợp chất theo điểm 15; và (2) ít nhất một hợp phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng.

20. Phương pháp bảo vệ thực vật hoặc hạt giống thực vật khỏi các bệnh do nấm gây bệnh gây ra bao gồm việc đưa hợp chất theo điểm 15 với một lượng hữu hiệu diệt nấm lên thực vật hoặc hạt giống thực vật.

21. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) là 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.

22. Hợp chất theo điểm 15, trong đó hợp chất này là 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.

23. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) là 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin; và hợp phần (b) bao gồm ít nhất

một hợp chất được chọn từ azoxystrobin, kresoxim-metyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, pyraoxystrobin, pyrametostrobin, picoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, carbendazim, clothalonil, quinoxifen, metrafenone, pyriofenone, cyflufenamid, fenpropidin, fenpropimorph, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, flusilazole, hexaconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, tebuconazole, triticonazole, famoxadone, prochloraz, penthiopyrad và boscalid (nicobifen).

24. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) là 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin; và (b) bao gồm ít nhất một hợp chất được chọn từ clothalonil, metconazole, prothioconazole và penthiopyrad.

25. Chế phẩm theo điểm 1, trong đó hợp phần (a) là 4-(2-clo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.

26. Hợp chất theo điểm 15, trong đó hợp chất này là 4-(2-bromo-4-flophenyl)-*N*-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1*H*-pyrazol-5-amin.