



(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)



1-0025927

(51)⁷ A01N 43/08; A01N 43/54; A01N 43/56; (13) B
A01N 43/653; A01N 43/713; A01N
43/76; A01P 3/00; A01N 43/80; A01N
43/82; A01N 43/88; A01N 43/90; A01N
47/24; A01N 47/28; A01N 37/50; A01N
43/78

(21) 1-2014-01930

(22) 06/12/2012

(86) PCT/EP2012/074586 06/12/2012

(87) WO 2013/092224 27/06/2013

(30) 11195032.5 21/12/2011 EP; 12190109.4 26/10/2012 EP

(45) 26/10/2020 391

(43) 25/11/2014 320A

(73) BASF SE (DE)

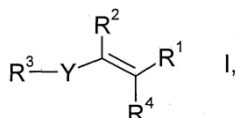
67056 Ludwigshafen (DE)

(72) RHEINHEIMER, Joachim (DE); TERTERYAN, Violeta (DE); REDLICH, Stefan (DE); KREMZOW, Doris (DE); ROSENBAUM, Claudia (DE); ROHRER, Sebastian Georgios (DE); GRAMMENOS, Wassilios (GR); PILGER, Christian (DE); RÖHL, Franz (DE); GEWEHR, Markus (DE); STAMMLER, Gerd (DE); MONTAG, Jurith (DE); SAUTER, Hubert (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT LOẠI STROBILURIN, PHƯƠNG PHÁP DIỆT NẤM GÂY BỆNH TRÊN CÂY CÓ TÍNH KHÁNG CHẤT ỨC CHẾ QO BẰNG CÁCH SỬ DỤNG HỢP CHẤT NÀY VÀ CHẾ PHẨM HOÁ NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY

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



phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây có tính kháng chất ức chế Qo bằng cách sử dụng hợp chất này. Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm hóa nông chứa ít nhất một hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất loại strobilurin có công thức I và các N-oxit và muối của chúng để diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến ở gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, và phương pháp diệt các loại nấm này. Sáng chế cũng đề cập đến các hợp chất mới, quy trình điều chế các hợp chất này, các chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này, các ứng dụng về sức khỏe cây trồng, và hạt được phủ với ít nhất một hợp chất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Thuốc diệt nấm chứa chất ức chế Qo, thường được nói đến là các thuốc diệt nấm loại strobilurin (Sauter 2007: Chapter 13.2. Strobilurins and other complex III inhibitors. In: Krämer, W.; Schirmer, U. (Ed.) – Modern Crop Protection Compounds. Volume 2. Wiley-VCH Verlag 457-495), thường được sử dụng để kiểm soát một số tác nhân gây bệnh do nấm ở cây trồng. Các chất ức chế Qo thường hoạt động bằng cách ức chế sự hô hấp bằng cách liên kết với tâm oxy hóa ubihydroquinon của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ (phức hệ vận chuyển electron III) trong ty lạp thể. Tâm oxy hóa nêu trên được đặt trên mặt bên ngoài của màng ty lạp thể bên trong. Ví dụ về việc sử dụng các chất ức chế Qo bao gồm việc sử dụng, ví dụ, của strobilurin trên cây lúa mì để kiểm soát *Septoria tritici* (cũng được biết đến là *Mycosphaerella graminicola*), mà là nguyên nhân của bệnh đốm lá trên cây lúa mì. Đáng tiếc là việc sử dụng rộng rãi của các chất ức chế Qo này đã dẫn đến sự chọn lọc của các tác nhân gây bệnh đột biến mà có khả năng chịu được các chất ức chế Qo này (Gisi et al., Pest Manag Sci 56, 833-841, (2000). Khả năng chịu được các chất ức chế Qo đã được phát hiện trong một số loại nấm gây bệnh trên cây như *Blumeria graminis*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Pseudoperonospora cubensis* hoặc *Venturia inaequalis*. Mặc dù một số cơ chế đề kháng đã được phát hiện trong lúc đó (ví dụ, Jabs et al. Phytomedizin 31, 15-16 (2001); Olaya et al., Pestic Sci 54, 230-236 (1998), một phần sức đề kháng chính đối với các chất ức

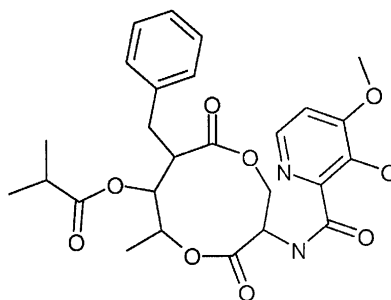
chế Qo trong sử dụng nông nghiệp đã đóng góp cho các tác nhân gây bệnh chứa duy nhất một sự thay thế phần cận axit amin G143A trong gen sắc tố tế bào b của phức hệ sắc tố tế bào bc₁, protein đích của các chất ức chế Qo. Xem, ví dụ, Lucas, Pestic Outlook 14(6), 268-70 (2003); và Fraaije et al., Phytopathol 95(8), 933-41 (2005), (cả hai được kết hợp trong tài liệu này chỉ để tham khảo).

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, mong muốn có các phương pháp và các chế phẩm mới để diệt tác nhân gây bệnh mà đã gây ra các bệnh ở cây trồng bao gồm thực vật phải chịu các tác nhân gây bệnh mà có khả năng chịu được các chất ức chế Qo. Hơn nữa, trong nhiều trường hợp, cụ thể là ở tỷ lệ sử dụng thấp, hoạt tính diệt nấm của các hợp chất tương tự strobilurin có tác dụng diệt nấm đã biết là không thỏa mãn, đặc biệt là trong trường hợp tỷ lệ cao các tác nhân gây bệnh do nấm chứa đột biến ở gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo. Do đó, mục đích của sáng chế là đề xuất các hợp chất có hoạt tính được cải thiện và/hoặc phổ hoạt tính chống lại nấm có hại gây bệnh trên cây rộng hơn.

“Chất ức chế Qo”, như được sử dụng ở đây, bao gồm chất bất kỳ có khả năng làm giảm và/hoặc ức chế sự hô hấp bằng cách liên kết với tâm oxy hóa ubihydroquinon của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ trong ty lạp thể. Tâm oxy hóa thường được đặt trên mặt bên ngoài của màng ty lạp thể bên trong.

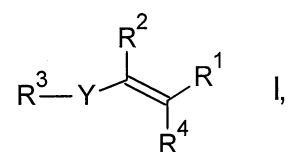
Từ WO 2009/155095, việc sử dụng chất ức chế Qi UK2A có công thức



là đã biết để diệt nấm gây bệnh trên cây mà có khả năng chịu được các chất ức chế Qo. Các chất ức chế Qi thường hoạt động bằng cách ức chế sự hô hấp bằng cách liên kết với tâm oxy hóa ubihydroquinon của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ trong ty lạp thể, tâm oxy hóa nêu trên được đặt trên mặt bên trong của màng ty lạp thể bên trong.

Các hợp chất tương tự strobilurin theo sáng chế khác với các hợp chất được mô tả trong công bố nêu trên bởi công thức I và bằng cách ức chế sự hô hấp bằng cách liên kết với tâm oxy hóa ubihydroquinon của phức hệ sắc tố tế bào bcl trong ty lạp thể mà định nghĩa chúng là các chất ức chế Qo. Ngoài các phần tử cấu trúc tương tự strobilurin R⁴, các hợp chất này chứa hai nguyên tử cacbon được liên kết bởi liên kết đôi trong đó gốc R¹ và R² được định hướng cis hoặc R¹ và R² cùng với hai nguyên tử cacbon nêu trên liên kết với nhau để tạo thành vòng phenyl nếu R⁴ là 4-metyl-1,4-dihydro-tetrazol-5-on-1-yl.

Theo đó, sáng chế đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức I



trong đó:

R¹, R² độc lập với nhau là hydro, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, trong đó gốc R¹ và R² được định hướng cis, hoặc

R¹ và R² cùng với hai nguyên tử cacbon liên kết với nhau để tạo thành vòng phenyl miễn là R⁴ là 4-metyl-1,4-dihydro-tetrazol-5-on-1-yl (công thức R4-7), và

trong đó các phần tử béo của R¹ và/hoặc R² hoặc vòng phenyl nêu trên có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^a giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^a halogen, CN, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl và C₁-C₄-haloalkoxy;

Y là liên kết trực tiếp hoặc gốc có hóa trị hai được chọn từ -OCH₂-, -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(Z)=N-O-CH₂-, -CHZ-C(Z)=N-O-CH₂-, -O-N=C(Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, -C(=O)-C(Z)=N-O-CH₂- và -C(=N-O-Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của gốc có hóa trị hai Y được gắn với R³, và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thế bởi R², và

Z, mà có thể là giống hoặc khác với Z bất kỳ khác, là hydro, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

R^3 là phenyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heteroxyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S;

trong đó nhóm xyclic R^3 có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^b giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ :

R^b , mà có thể giống hoặc khác với R^b bất kỳ khác, là amino, halogen, hydroxyl, oxo, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyl-oxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng, mà ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó gốc phenyl và heteroxyclyl R^b nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh, và

hai gốc R^b mà được liên kết với các nguyên tử cạnh vòng liền kề của nhóm xyclic R^3 có thể tạo thành cùng với các nguyên tử cạnh vòng nêu trên một vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm nóng chảy có 5, 6 hoặc 7 cạnh vòng, mà có thể là vòng cacbon hoặc vòng khác loại, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của vòng khác loại bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S,

và

trong đó gốc béo hoặc nhóm xyclic R^b có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^c giống nhau hoặc khác nhau:

R^c , mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxyimino-, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino-, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino-, C_2 - C_6 -haloalkenyloxyimino-, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, phenyl hoặc heteroxyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc

thơm có 5 cạnh vòng, mà ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; trong đó các nhóm xyclic R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh, và trong đó các gốc béo hoặc nhóm xyclic R^c có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^d giống nhau hoặc khác nhau:

R^d, mà có thể giống hoặc khác với R^d bất kỳ khác, là halogen, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

hoặc

R³ là -CR^A=N-O-R^B, trong đó

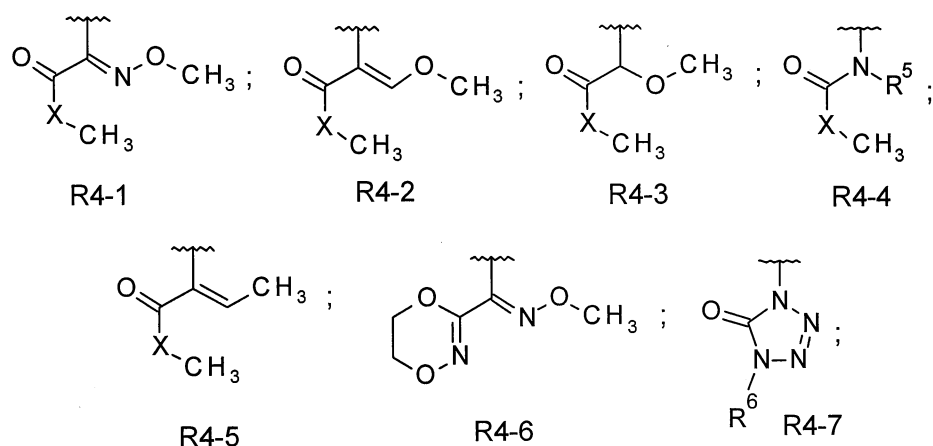
R^A là amino, hydroxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylamino, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, C₁-C₄-alkylcarbonyloxy, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và trong đó xyclic R^A nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh;

R^B là C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng;

trong đó các gốc béo hoặc nhóm xyclic R^A và/hoặc R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^e giống nhau hoặc khác nhau:

R^e, mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy hoặc C₁-C₄-haloalkoxy;

R⁴ là gốc có hóa trị một được chọn từ các công thức R4-1 đến R4-7



trong đó đường răng cưa xác định điểm liên kết, và

X là liên kết trực tiếp hoặc gốc có hóa trị hai CH_2 , O hoặc NH,

R^5 là C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -haloalkoxy hoặc C_3 - C_6 -xycloalkyl,

R^6 là C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl;

và các N-oxit và muối được chấp nhận trong nông nghiệp của chúng, để diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến ở gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo.

Hơn nữa, sáng chế cũng đề cập đến các phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến ở gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo bằng cách sử dụng các hợp chất có công thức I nêu trên.

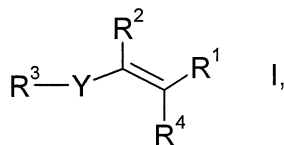
Các hợp chất loại strobilurin có công thức I, trong đó R^4 là 1-metoxycarbonyl-2-metoxymeth-1-yl (được xác định là R4-2 ở trong tài liệu này, trong đó X là O) và R^1 là CF_3 , được đề cập trong WO 1998/021174: metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(4-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic (CAS No. 207852-99-1); metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(3-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic (207853-00-7); metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-4-metyl-5-(3-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic; và metyl este của axit (E)-5,5,5-triflo-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-3-metyl-4-(4-phenoxy-phenoxy-metyl)-pent-3-enoic. Tuy nhiên, sáng chế không đề cập rằng các hợp chất loại strobilurin ức chế các tác nhân gây bệnh do nấm chứa đột biến ở gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo. II

Hơn nữa, điều chế hợp chất methyl este của axit (2E,3Z)-2-(etyliden)-5-phenyl-3-pentenoic (CAS-No. 681026-20-0) đã được mô tả trong J Organomet Chem 689, 575-584 (2004).

Hơn nữa, các hợp chất loại strobilurin, trong đó R¹ và R² cùng với hai nguyên tử cacbon liên kết với nhau để tạo thành vòng phenyl và trong đó R⁴ là 1-metyl-1,4-dihydro-tetrazol-5-on-4-yl (R4-7) là đã biết, không kể những thứ khác, từ WO 1996/036229, WO 1999/046246 và DE 199 00 571 A1.

Các hợp chất theo sáng chế khác với các hợp chất được mô tả trong các công bố đơn nêu trên là R¹ và R² không tạo thành với hai nguyên tử cacbon liên kết với chúng vòng phenyl, và methyl este của axit (E)-2-[1-metoxymethyl-(E)-yliden]-5-(4-phenoxyphenoxy)-3-triflormetyl-pent-3-enoic (207852-99-1); methyl este của axit (E)-2-[1-metoxymethyl-(E)-yliden]-5-(3-phenoxyphenoxy)-3-triflormetyl-pent-3-enoic (207853-00-7); methyl este của axit (E)-2-[1-metoxymethyl-(E)-yliden]-4-metyl-5-(3-phenoxyphenoxy)-3-triflormetyl-pent-3-enoic; methyl este của axit (E)-5,5,5-trifluoro-2-[1-metoxymethyl-(E)-yliden]-3-metyl-4-(4-phenoxyphenoxy)-pent-3-enoic; và methyl este của axit (2E,3Z)-2-(etyliden)-5-phenyl-3-pentenoic (CAS-No. 681026-20-0) được loại trừ.

Do đó, theo khía cạnh thứ hai, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức I mà được trình bày bởi công thức I



trong đó:

R¹, R² độc lập với nhau là hydro, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, trong đó các gốc R¹ và R² được định hướng cis,

trong đó các phân tử béo của R¹ và/hoặc R² có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^a giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^a halogen, CN, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl và C₁-C₄-haloalkoxy;

Y là liên kết trực tiếp hoặc gốc có hóa trị hai được chọn từ $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{CHZ}-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ và $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của gốc có hóa trị hai Y được gắn với R^3 , và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thế bởi R^2 , và Z, mà có thể giống hoặc khác với Z bất kỳ khác, là C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl;

R^3 là phenyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heterocyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm N, O và S;

trong đó nhóm xyclic R^3 có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^b giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^b , mà có thể giống hoặc khác với R^b bất kỳ khác, là amino, halogen, hydroxyl, oxo, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, naphthyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó các gốc phenyl và heterocyclyl R^b nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh; và

hai gốc R^b mà được liên kết với các nguyên tử cạnh vòng liên kề của nhóm xyclic R^3 có thể tạo thành cùng với các nguyên tử cạnh vòng nêu trên vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm nóng chảy có 5, 6 hoặc 7 cạnh vòng, mà có thể là vòng cacbon hoặc vòng khác loại, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của vòng khác loại nóng chảy bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S, và

trong đó các gốc béo hoặc nhóm xyclic R^b có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối

đa các gốc R^c giống nhau hoặc khác nhau:

R^c , mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxyimino-, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino-, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino-, C_2 - C_6 -haloalkenyloxyimino-, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, phenyl hoặc heterocyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; trong đó các nhóm xyclic R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh và trong đó các gốc béo hoặc nhóm xyclic R^c có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^d giống nhau hoặc khác nhau.

R^d , mà có thể giống hoặc khác R^d bất kỳ khác, là halogen, C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl;

hoặc

R^3 là $-CR^A=N-O-R^B$, trong đó

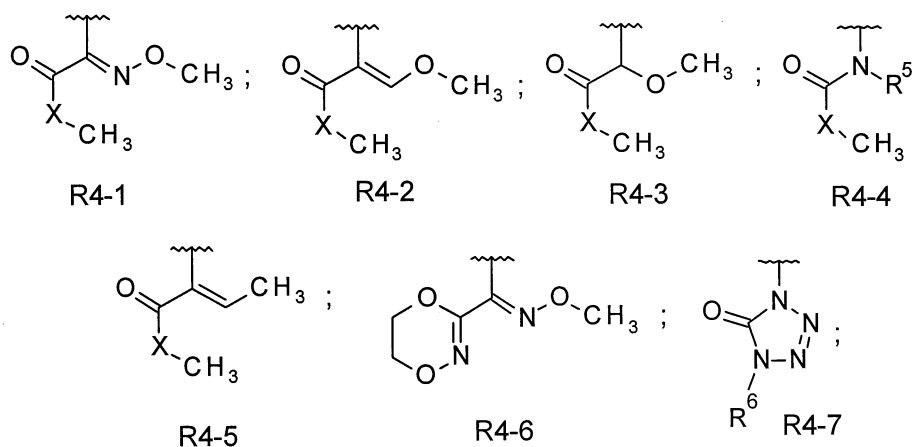
R^A là amino, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, phenyl- C_1 - C_4 -alkyl, naphtyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và trong đó xyclic R^A nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh;

R^B là C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, CC_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, phenyl, phenyl- C_1 - C_4 -alkyl, naphtyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng;

trong đó các gốc béo hoặc nhóm xyclic R^A và/hoặc R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các gốc R^e giống nhau hoặc khác nhau:

R^e , mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy;

R^4 là gốc có hóa trị một được chọn từ các công thức R4-1 đến R4-7



trong đó đường răng cưa xác định điểm điểm liên kết, và trong đó

X là gốc có hóa trị hai O hoặc NH,

R^5 là C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -haloalkoxy hoặc C_3 - C_6 -xycloalkyl,

R^6 là C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl;

và các N-oxit và muối được chấp nhận trong nông nghiệp của chúng, ngoại trừ metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(4-phenoxyphenoxy)-3-triflometylpent-3-enoic (207852-99-1), metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(3-phenoxyphenoxy)-3-triflometylpent-3-enoic (207853-00-7); metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-4-metyl-5-(3-phenoxyphenoxy)-3-triflometylpent-3-enoic, metyl este của axit (E)-5,5,5-triflo-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-3-metyl-4-(4-phenoxyphenoxy)-3-triflometylpent-3-enoic, và metyl este của axit (2E,3Z)-2-(etyliden)-5-phenyl-3-pentenoic (CAS-No. 681026-20-0).

Mô tả vắn tắt hình vẽ

Fig. 1: Fig. 1 là mô hình cấu trúc của vị trí liên kết đột biến G143A. Hợp chất Pyraclostrobin tương tự strobilurin bán sẵn trên thị trường được mô hình thành vị trí liên

kết Qo của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ nhân tạo thể hiện sự va chạm về không gian của vòng phenyl với nhóm methyl 143A như được biểu thị bởi mũi tên ở phần bên phải phía trên của Fig. 1 (bên trái). Hợp chất có công thức I-6 theo sáng chế không thể hiện sự va chạm về không gian (bên phải).

Mô tả chi tiết sáng chế

Thuật ngữ “các hợp chất có công thức I” đề cập đến các hợp chất có công thức I. Cũng như vậy, thuật ngữ này áp dụng cho tất cả các công thức con, ví dụ, “các hợp chất có công thức I.2” đề cập đến các hợp chất có công thức I.2 hoặc “các hợp chất có công thức V” đề cập đến các hợp chất có công thức V, v.v...

Các hợp chất có công thức I có thể thu được bằng nhiều cách khác nhau tương tự với các quy trình đã biết thuộc tình trạng kỹ thuật của sáng chế (ví dụ, WO 1998/021174, J Organomet Chem 689, 575-584 (2004), WO 1996/036229) và, có lợi nếu bằng cách tổng hợp được thể hiện trong các sơ đồ sau đây và trong phần thí nghiệm của đơn này.

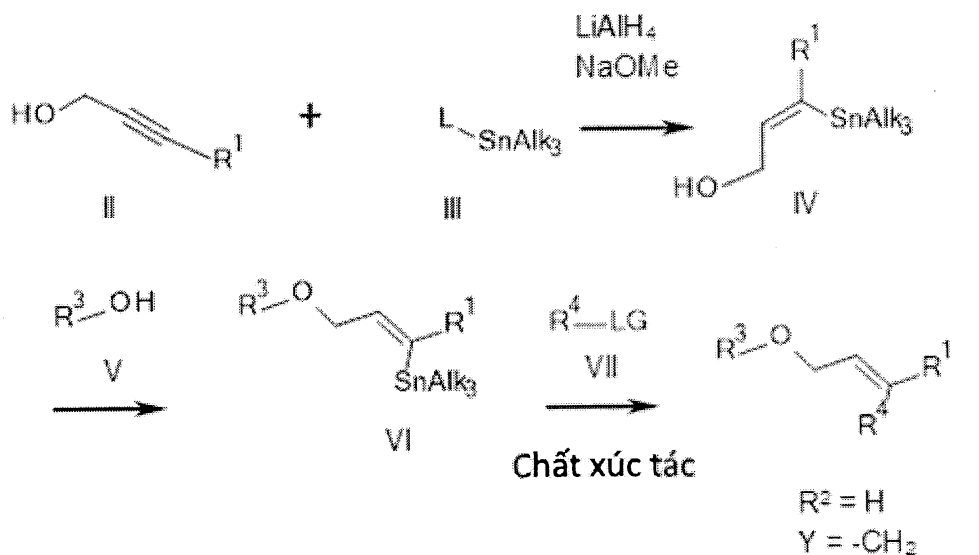
Phương pháp thích hợp để điều chế các hợp chất có công thức I được minh họa trong sơ đồ 1. Phương pháp bắt đầu với việc khử hợp chất axetylen có công thức II bằng chất khử như lithi nhôm hydrua, tốt hơn là với sự có mặt của dung môi. Các dung môi thích hợp là trơ đối với chất khử được sử dụng và tốt hơn là được chọn từ ete vòng hoặc béo như ete dietyl, tetrahydrofuran (THF), 1,4-dioxan, và methyl-tert.-butyl ete (MTBE). Nhiệt độ phản ứng có thể nằm trong khoảng từ -40°C đến 100°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ -20 đến 60°C. Sau khi tạo thành chất trung gian được khử, hợp chất thiếc có công thức III, trong đó Alk xác định phần cận alkyl thích hợp như methyl, etyl, n-propyl, hoặc n-butyl và trong đó L là nhóm rời chuyển như halogen, etoxy và metoxy, đặc biệt là metoxy, được bổ sung vào. Chất trung gian thu được có công thức IV là hợp chất ổn định mà có thể được tách và tinh chế bằng các phương pháp thông thường (ví dụ, chiết và phép sắc ký).

Hợp chất có công thức IV được phản ứng tiếp với hợp chất có công thức V để thu được chất trung gian có công thức VI bằng cách sử dụng các phương pháp thông thường để liên kết các rượu béo với các hợp chất hydroxyl có công thức IV. Phản ứng Mitsunobu đã chứng tỏ là đặc biệt có ích.

Sau đó, hợp chất có công thức VI được liên kết với hợp chất có công thức VII, trong đó LG là nhóm rời chuyển, tốt hơn là halogen (ngoại trừ flo) hoặc nhóm sulfonyloxy như triflat, tốt hơn là với sự có mặt của chất xúc tác thích hợp như các chất xúc tác kim loại chuyển tiếp đã biết, tốt hơn nữa là các chất xúc tác paladi, trong đó phối tử có thể là các phối tử trifuryl phoshin, triphenyl phosphin, tritolyl phosphin hoặc bidentat phosphin. Các hợp chất đồng, như CuI_2 có thể được bổ sung vào để cải thiện phản ứng. Có thể sử dụng nhiều dung môi khác nhau, trong đó ưu tiên THF, 1,4-dioxan và amit như dimetylformamit (DMF). Nhiệt độ phản ứng có thể nằm trong khoảng từ -20 đến 150°C , tốt hơn là nằm trong khoảng từ 20 đến 120°C .

Các hợp chất thu được có công thức I, trong đó Y là $-\text{OCH}_2-$ và R^2 là H, có thể được cải biến thêm. Ví dụ, nếu R^4 chứa nhóm este, VIII có thể được biến thành metyl amit bằng phản ứng với metyl amin.

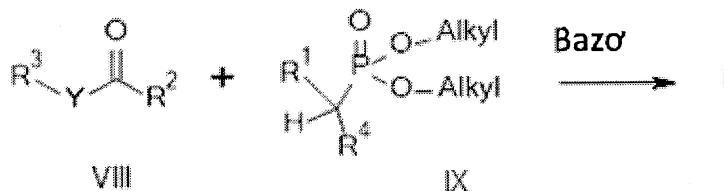
Sơ đồ 1:



Một phương pháp thông thường khác để điều chế các hợp chất có công thức I được minh họa trong sơ đồ 2. Các vật liệu thu được có công thức VIII hoặc là đã biết hoặc có thể được điều chế tương tự với các hợp chất đã biết. Phản ứng Wittig-Horner của các hợp chất có công thức VIII với các hợp chất có công thức IX được minh họa ở đây (xem Tetrahedron Lett. 1988, 29, 3361) có thể được thay thế bằng phản ứng Wittig nếu phản ứng này thu được sản lượng tốt hơn. Các phản ứng này cũng như điều kiện phản ứng là đã biết. Vấn đề ở đây là tỷ lệ E/Z trong liên kết đôi mới được tạo

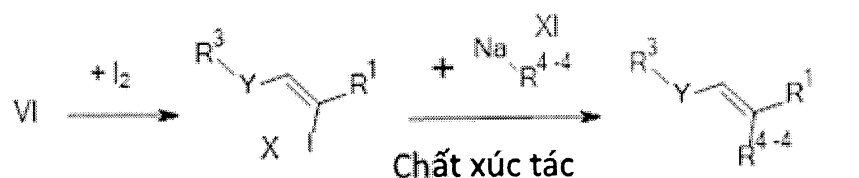
thành. Chất đồng phân mong muốn thường đi kèm với chất đồng phân không mong muốn, mà phải được loại bỏ bằng cách tinh chế đã biết trong lĩnh vực (ví dụ, phép sắc ký, chưng cất, kết tinh, v.v...).

Sơ đồ 2:



Cách điều chế các hợp chất có công thức I, trong đó R⁴ có công thức R⁴-4, được minh họa trong sơ đồ 3. Hợp chất có công thức X có thể đạt được, ví dụ, từ hợp chất có công thức VI bằng phản ứng trực tiếp với iot. Iot trong các hợp chất có công thức X có thể được thay thế bằng các nhóm rời chuyển thích hợp khác, ví dụ, bằng brom, clo hoặc triflat. Nguyên tử natri trong muối có công thức VII có thể được thay thế bằng các nguyên tử kim loại thích hợp khác, ví dụ, kali, lithi, magiê, canxi, v.v... Phản ứng liên kết của X và XI được thực hiện, tốt hơn là với sự có mặt của chất xúc tác kim loại chuyển tiếp, tốt hơn là đồng với sự có mặt của nitor chứa hệ thống phối tử (xem, ví dụ, Tetrahedron Lett 2008, 49 (26), 4196-4199; Org Lett. 2004, 6 (11), 1809-1812).

Sơ đồ 3:



Nếu các hợp chất riêng lẻ có công thức I không thể đạt được bằng các cách như mô tả trên đây, chúng có thể được thay thế bằng sự dẫn xuất của các hợp chất có công thức I khác.

Nếu tổng hợp thu được các hỗn hợp của các chất đồng phân trong trường hợp của các oxim, thì việc tách thường là không cần thiết do trong một số trường hợp các

chất đồng phân riêng lẻ có thể được hoán chuyển trong khi điều chế để sử dụng hoặc trong khi sử dụng (ví dụ, dưới tác động của ánh sáng, axit hoặc bazơ). Sự chuyển hóa này cũng có thể diễn ra sau khi sử dụng, ví dụ, trong xử lý thực vật ở thực vật được xử lý, hoặc ở các nấm có hại được kiểm soát.

Trong phần định nghĩa của các biến nêu trên, các thuật ngữ chung được sử dụng thường đại diện cho các phân tử thay thế đang đề cập đến. Thuật ngữ “C_n-C_m” biểu thị số lượng các nguyên tử cacbon có thể có trong từng trường hợp trong phân tử thay thế hoặc trong phân tử thay thế đang đề cập đến.

Thuật ngữ “halogen” đề cập đến flo, clo, brom và iot.

Thuật ngữ “C₁-C₆-alkyl” đề cập đến nhóm hydrocacbon bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, metyl, etyl, propyl, 1-metyl-etyl, butyl, 1-metylpropyl, 2-metylpropyl (isobutyl), 1,1-dimetyletyl, pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, 1,1-dimetylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, 1-metylpentyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 4-metylpentyl, 1,1-dimetylbutyl, 1,2-dimetylbutyl, 1,3-dimetylbutyl, 2,2-dimetylbutyl, 2,3-dimetylbutyl, 3,3-dimetylbutyl, 1-etylbutyl, 2-etylbutyl, 1,1,2-trimetylpropyl, 1,2,2-trimetylpropyl, 1-etyl-1-metylpropyl và 1-etyl-2-metylpropyl. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₄-alkyl” đề cập đến nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ “C₁-C₄-haloalkyl” đề cập đến nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó một số hoặc tất cả các nguyên tử hydro trong các nhóm này có thể được thay thế bởi các nguyên tử halogen như được nêu trên, ví dụ, clometyl, bromometyl, diclometyl, triclometyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, cloflometyl, dicloflometyl, clodiflometyl, 1-cloetyl, 1-bromoetyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 2-clo-2-floetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 2,2-diclo-2-floetyl, 2,2,2-tricloetyl và pentaflloetyl, 2-flopropyl, 3-flopropyl, 2,2-diflopropyl, 2,3-diflopropyl, 2-clopropyl, 3-clopropyl, 2,3-diclopropyl, 2-bromopropyl, 3-bromopropyl, 3,3,3-triflopropyl, 3,3,3-triclopropyl, CH₂-C₂F₅, CF₂-C₂F₅, CF(CF₃)₂, 1-(flometyl)-2-floetyl, 1-(clometyl)-2-cloetyl, 1-(bromometyl)-2-bromoetyl, 4-flobutyl, 4-clobutyl, 4-bromobutyl hoặc nonaflobutyl.

Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₆-haloalkyl” đề cập đến nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ “C₁-C₆-alkoxy” đề cập đến nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon mà được liên kết qua oxy, tại vị trí bất kỳ trong nhóm alkyl, ví dụ, OCH₃, OCH₂CH₃, O(CH₂)₂CH₃, 1-metyletoxy, O(CH₂)₃CH₃, 1-metyl-propoxy, 2-metylpropoxy hoặc 1,1-dimetyletoxy, O(CH₂)₄CH₃ hoặc O(CH₂)₅CH₃. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₄-alkoxy” đề cập đến nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon mà được liên kết qua oxy, tại vị trí bất kỳ trong nhóm alkyl.

Thuật ngữ “C₁-C₄-haloalkoxy” đề cập đến nhóm C₁-C₄-alkoxy như được xác định nêu trên, trong đó một số hoặc tất cả các nguyên tử hydro có thể được thay thế bởi các nguyên tử halogen như nêu trên, ví dụ, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, cloflometoxy, dicloflometoxy, clodiflometoxy, 2-floetoxi, 2-cloetoxi, 2-bromoetoxi, 2-iodoetoxi, 2,2-difloetoxi, 2,2,2-trifloetoxi, 2-clo-2-floetoxi, 2-clo-2,2-difloetoxi, 2,2-diclo-2-floetoxi, 2,2,2-tricloetoxi, OC₂F₅, 2-flopropoxy, 3-flopropoxy, 2,2-diflopropoxy, 2,3-diflopropoxy, 2-clopropoxy, 3-clopropoxy, 2,3-diclopropoxy, 2-bromopropoxy, 3-bromopropoxy, 3,3,3-triflopropoxy, 3,3,3-triclopropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-floetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloetoxi, 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi, 4-flobutoxy, 4-clobutoxy, 4-bromobutoxy hoặc nonaflobutoxy. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₆-haloalkoxy” đề cập đến nhóm C₁-C₆-alkoxy như được xác định trên đây, trong đó một số hoặc tất cả các nguyên tử hydro có thể được thay thế bởi các nguyên tử halogen như nêu trên.

Thuật ngữ “C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, trong đó một nguyên tử hydro của gốc alkyl được thay thế bởi nhóm C₁-C₄-alkoxy. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, trong đó một nguyên tử hydro của gốc alkyl được thay thế bởi nhóm C₁-C₆-alkoxy.

Thuật ngữ “C₁-C₄-alkylamino” đề cập đến gốc amino mang một nhóm C₁-C₄-alkyl như là phần tử thay thế, ví dụ, metylamino, etylamino, propylamino, 1-metyletylamino, butylamino, 1-metylpropylamino, 2-metylpropylamino, 1,1-di-

metyletylamino và các nhóm tương tự. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₁-C₆-alkylamino” đề cập đến gốc amino mang một nhóm C₁-C₆-alkyl như là phần tử thay thế.

Thuật ngữ “di(C₁-C₄-alkyl)amino” đề cập đến gốc amino mang hai nhóm C₁-C₄-alkyl giống nhau hoặc khác nhau như là các phần tử thay thế, ví dụ, dimetylamino, dietylamino, di-n-propylamino, diisopropylamino, N-etyl-N-metylamino, N-(n-propyl)-N-metylamino, N-(isopropyl)-N-metylamino, N-(n-butyl)-N-metylamino, N-(2-butyl)-N-metylamino, N-(isobutyl)-N-metylamino, và các nhóm tương tự. Cũng như vậy, thuật ngữ “di(C₁-C₆-alkyl)amino” đề cập đến gốc amino mang hai nhóm C₁-C₆-alkyl giống nhau hoặc khác nhau là các phần tử thay thế.

Thuật ngữ “C₁-C₄-alkoxyimino” đề cập đến gốc imino có hóa trị hai (C₁-C₄-alkyl-O-N=) mang một nhóm C₁-C₄-alkoxy như là phần tử thay thế, ví dụ, metylimino, etylimino, propylimino, 1-metyletylimino, butylimino, 1-metylpropylimino, 2-metylpropylimino, 1,1-dimetyletylimino và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ “C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó hai nguyên tử hydro của một nguyên tử cacbon của gốc alkyl được thay thế bởi gốc C₁-C₆-alkoxyimino có hóa trị hai (C₁-C₆-alkyl-O-N=) như được xác định trên đây.

Thuật ngữ “C₂-C₆-alkenyloxyimino-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó hai nguyên tử hydro của một nguyên tử cacbon của gốc alkyl được thay thế bởi gốc C₂-C₆-alkenyloxyimino có hóa trị hai (C₂-C₆-alkenyl-O-N=).

Thuật ngữ “C₂-C₆-alkynyloxyimino-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó hai nguyên tử hydro của một nguyên tử cacbon của gốc alkyl được thay thế bởi gốc C₂-C₆-alkynyloxyimino có hóa trị hai (C₂-C₆-alkynyl-O-N=).

Thuật ngữ “C₁-C₄-alkylcarbonyl” đề cập đến gốc C₁-C₄-alkyl mà được gắn qua nhóm carbonyl. Thuật ngữ “(C₁-C₆-alkoxy)carbonyl” đề cập đến gốc C₁-C₆-alkoxy mà được gắn qua nhóm carbonyl.

Thuật ngữ “C₁-C₆-alkylaminocarbonyl” đề cập đến gốc C₁-C₆-alkylamino được

gắn qua nhóm carbonyl. Cũng như vậy, thuật ngữ “di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl” đề cập đến gốc di(C₁-C₆)alkylamino mà được gắn qua nhóm carbonyl.

Thuật ngữ “C₂-C₄-alkenyl” đề cập đến gốc hydrocacbon không bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 4 nguyên tử cacbon và một liên kết đôi tại vị trí bất kỳ, ví dụ, etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl (allyl), 1-metyletenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-metyl-1-propenyl, 2-metyl-1-propenyl, 1-metyl-2-propenyl, 2-metyl-2-propenyl. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₂-C₆-alkenyl” đề cập đến gốc hydrocacbon không bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon và một liên kết đôi tại vị trí bất kỳ.

Thuật ngữ “C₂-C₄-alkynyl” đề cập đến gốc hydrocacbon không bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 4 nguyên tử cacbon và chứa ít nhất một liên kết ba, như etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, 3-butylnyl, 1-metyl-2-propynyl. Cũng như vậy, thuật ngữ “C₂-C₆-alkynyl” đề cập đến gốc hydrocacbon không bão hòa mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon và ít nhất một liên kết ba.

Thuật ngữ “C₃-C₆-xycloalkyl” đề cập đến gốc hydrocacbon bão hòa đơn vòng, hai vòng có từ 3 đến 6 cạnh vòng cacbon, như xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl.

Cũng như vậy, thuật ngữ “C₃-C₆-xycloalkenyl” đề cập đến các gốc hydrocacbon không bão hòa có từ 3 đến 6 cạnh vòng cacbon và một liên kết đôi ở vị trí bất kỳ, như xyclopropenyl, xyclobutenyl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl.

Thuật ngữ “C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó một nguyên tử hydro của gốc alkyl được thay thế bởi gốc xycloalkyl có từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon.

Thuật ngữ “phenyl-C₁-C₄-alkyl” đề cập đến alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được xác định trên đây), trong đó một nguyên tử hydro của gốc alkyl được thay thế bởi gốc phenyl.

Các muối được chấp nhận trong nông nghiệp của các hợp chất có công thức I bao gồm các muối của các cation này hoặc các muối cộng axit của các axit này mà các

cation và anion của nó lần lượt không có ảnh hưởng bất lợi đối với tác dụng diệt nấm của các hợp chất có công thức I. Do đó, các cation thích hợp cụ thể là các ion của các kim loại kiềm, tốt hơn là natri và kali, của các kim loại kiềm thổ, tốt hơn là canxi, magiê và bari, của các kim loại chuyển tiếp, tốt hơn là mangan, đồng, kẽm và sắt, và cả amoni ion mà, nếu muốn, có thể mang từ một đến bốn phần tử thay thế C₁-C₄-alkyl và/hoặc một phần tử thay thế phenyl hoặc benzyl, tốt hơn là diisopropylamoni, tetramethylamoni, tetrabutylamoni, trimethylbenzylamoni, ngoài ra còn có các phosphoni ion, sulfoni ion, tốt hơn là tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoni, và các sulfoxoni ion, tốt hơn là tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxoni. Các anion của các muối cộng axit hữu ích chủ yếu là clo-rua, bromua, florua, hydrosulfat, sulfat, dihydrophosphat, hydrophosphat, phosphat, nitrat, bicarbonat, carbonat, hexaflosilicat, hexaflophosphat, benzoat, và các anion của axit C₁-C₄-alkanoic, tốt hơn là format, axetat, propionat và butyrat. Chúng có thể được tạo thành bằng cách cho hợp chất có công thức I phản ứng với axit của anion tương ứng, tốt hơn là của axit clohydric, axit bromhydric, axit sulfuric, axit phosphoric hoặc axit nitric.

Các hợp chất có công thức I có thể có mặt trong các atropisome xuất hiện từ việc quay giới hạn về liên kết đơn của các nhóm không đối xứng. Chúng cũng tạo thành một phần của đối tượng theo sáng chế.

Phụ thuộc vào kiểu thay thế, các hợp chất có công thức I và các N-oxit của chúng có thể có một hoặc nhiều tâm không đối xứng, trong trường hợp này, chúng có mặt như các chất đồng phân đối ảnh tinh khiết hoặc chất đồng phân không đối quang tinh khiết hoặc như hỗn hợp của các chất đồng phân đối ảnh hoặc chất đồng phân không đối quang. Cả chất đồng phân đối ảnh tinh khiết và chất đồng phân không đối quang tinh khiết và hỗn hợp của chúng đều là đối tượng của sáng chế.

Liên quan đến các biến, các phương án của các chất trung gian tương ứng với các phương án của các hợp chất có công thức I.

Ưu tiên các hợp chất có công thức I này và nếu thích hợp cũng ưu tiên cả các hợp chất có các công thức con được đưa ra ở đây, ví dụ, các công thức I.1 và I.2, và ưu tiên cả các chất trung gian như các hợp chất có công thức II, III, IV và V, trong đó các phần tử thay thế và các biến (như k, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, X, Y, Z, R^A, R^B, R^a, R^b

R^c , R^d và R^e) độc lập với nhau hoặc tốt hơn nữa là kết hợp với nhau (sự kết hợp bất kỳ của 2 hay nhiều phần tử thay thế như được xác định trong tài liệu này) có các nghĩa sau đây:

Cũng ưu tiên đối với việc sử dụng, phương pháp, hỗn hợp và chế phẩm, trong đó các định nghĩa (như nấm gây bệnh trên cây, xử lý, cây trồng, hợp chất có công thức II, ngoài ra còn có các thành phần hoạt tính, dung môi, chất mang dạng rắn) độc lập với nhau hoặc tốt hơn nữa là kết hợp với nhau có các nghĩa sau đây và thậm chí tốt hơn nữa là kết hợp (sự kết hợp bất kỳ của 2 hay nhiều định nghĩa như được đề cập trong tài liệu này) với các nghĩa được ưu tiên của các hợp chất có công thức I trong tài liệu này:

Theo một khía cạnh của sáng chế, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, bao gồm: xử lý nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo hoặc vật liệu, thực vật, cây trồng hoặc hạt giống mà có nguy cơ bị bệnh từ nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo với một lượng có tác dụng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức I, hoặc chế phẩm chứa chúng.

Thuật ngữ “nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo” được hiểu là ít nhất 10% nấm được kiểm soát chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, tốt hơn nữa là ít nhất 30%, thậm chí tốt hơn nữa là ít nhất 50%, và tốt nhất là ít nhất 75% nấm, cụ thể là nằm trong khoảng từ 90 đến 100%.

Các tác giả sáng chế quan sát dưới điều kiện đồng ruộng và thấy rằng số lượng nấm gây bệnh trên cây bao gồm các giống không có sức đề kháng có thể phát triển sức đề kháng một cách dễ dàng. Các hợp chất cũng có thể được sử dụng dưới điều kiện này để ngăn tạo thành sức đề kháng và mở rộng các giống có sức đề kháng. Về vấn đề này, sẽ là có ích nếu chúng có hoạt tính mạnh chống lại các nấm gây bệnh trên cây không có sức đề kháng.

Theo một khía cạnh khác, phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây, bao gồm: a) nhận biết nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây

tính kháng chất ức chế Qo, hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống mà có nguy cơ bị bệnh từ nấm gây bệnh trên cây như được xác định trong tài liệu này, và b) xử lý nấm hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống nêu trên với một lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức I, hoặc chế phẩm chứa chúng.

Theo một khía cạnh khác của sáng chế, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, bao gồm: xử lý nấm gây bệnh trên cây mà ít nhất 10% chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống mà có nguy cơ bị bệnh từ nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo với một lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức I, hoặc chế phẩm chứa chúng; tốt hơn nữa là ít nhất 30%, thậm chí tốt hơn nữa là ít nhất 50%, và tốt nhất là ít nhất 75% nấm chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo.

Theo một khía cạnh của việc sử dụng và phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây, trong đó đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b của nấm gây bệnh trên cây là G143A.

Theo một phương án khác, nấm gây bệnh trên cây được chọn từ nhóm bao gồm nấm đảm, lớp nấm nang, và oomycetes.

Theo một phương án nữa, nấm gây bệnh trên cây được chọn từ nhóm bao gồm *Alternaria alternata*, *Blumeria graminis*, *Pyricularia oryzae* (cũng được biết đến là *Magnaporthe grisea*), *Septoria tritici* (cũng được biết đến là *Mycosphaerella graminicola*), *Mycosphaerella fijiensis*, *Venturia inaequalis*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis* và *Plasmopara viticola*, cụ thể là *Septoria tritici*.

Một phương án của sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó R¹ là halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, trong đó các phân tử béo của R¹ có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ halogen, CN, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl và C₁-C₄-haloalkoxy; tốt hơn nữa R¹ là halogen, C₁-C₄-

alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkoxy-C₁-C₄-alkyl; thậm chí tốt hơn nữa R¹ là halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-cloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkoxy-C₁-C₄-alkyl; cụ thể là C₁-C₄-alkyl.

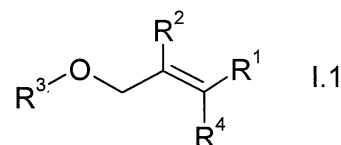
Theo một phương án khác, nếu R⁴ là 1-metoxycarbonyl-2-metoxymeten-1-yl (R⁴-2, trong đó X là O), R¹ không thể là CF₃.

Theo một phương án nữa, R² là hydro, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkoxy-C₁-C₄-alkyl; tốt hơn nữa R² là hydro, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, hoặc C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl; thậm chí tốt hơn nữa R² là hydro, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-alkoxy; cụ thể là hydro.

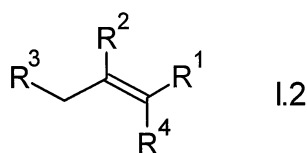
Theo một phương án nữa, R² là halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, trong đó các phân tử béo của R² có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^a giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ halogen, CN, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl và C₁-C₄-haloalkoxy.

Theo một phương án nữa, Z là hydro hoặc metyl, cụ thể là metyl.

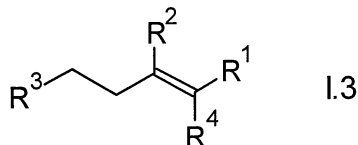
Theo một phương án nữa, Y là nhóm có hóa trị hai được chọn từ -OCH₂-, -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)=N-O-CH₂-, -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂- và -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-; tốt hơn nữa là -OCH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)=N-O-CH₂-, -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂- hoặc -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-, trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của nhóm có hóa trị hai Y được gắn với R³, và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thay thế bởi R²; cụ thể Y là -OCH₂, các hợp chất này có công thức I.1:



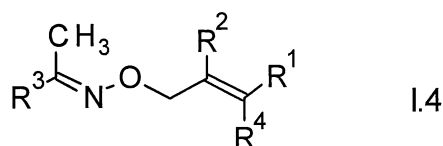
Theo một phương án nữa, Y là -CH₂-, các hợp chất này có công thức I.2:



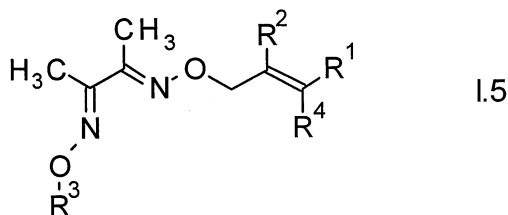
Theo một phương án nữa, Y là $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, các hợp chất này có công thức I.3:



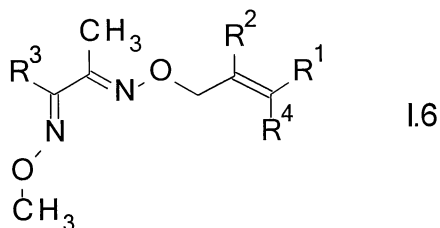
Theo một phương án nữa, Y là $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, các hợp chất này có công thức I.4:



Theo một phương án nữa, Y là $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, các hợp chất này có công thức I.5:



Theo một phương án nữa, Y là $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$, các hợp chất này có công thức I.6:



Các phương án được đặc biệt ưu tiên theo sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó nhóm Y là một trong số các gốc từ Y-1 đến Y-10 sau đây, trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của nhóm có hóa trị hai Y được gắn với R^3 , và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thay thế bởi R^2 :

Số	Y
----	---

Số	Y
Y-1	-OCH ₂ -
Y-2	-CH ₂ -
Y-3	-CH ₂ CH ₂ -
Y-4	-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-5	-O-N=C(CH ₃)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -

Số	Y
Y-6	-C(=N-O-CH ₃)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-7	-CH ₂ -C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-8	-C(=O)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-9	-CH ₂ OCH ₂ -
Y-10	-CH=N-O-CH ₂ -

Các phương án được đặc biệt ưu tiên của sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó nhóm Y là -OCH₂-.

Theo một phương án nữa, R³ là phenyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heterocyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S, trong đó R³ có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này; tốt hơn nữa là heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng nêu trên là heteroaryl có từ 5 đến 6 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heteroaryl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S.

Theo một phương án nữa, R³ là phenyl, trong đó phenyl có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này.

Theo một phương án nữa, R³ là heteroaryl có 5 cạnh vòng, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heterocyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S, trong đó heteroaryl có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này; tốt hơn nữa là heteroaryl nêu trên là pyrazolyl, imidazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl hoặc 1,2,4-thiadiazolyl.

Theo một phương án nữa, R^3 là pyrazolyl, imidazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl hoặc 1,2,4-thiadiazolyl, mà được thay thế bởi phenyl, trong đó phenyl nêu trên có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^c giống nhau hoặc khác nhau, mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, trong đó R^c là halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, phenyl hoặc heterocyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó các nhóm heterocyclyl R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh và có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^d giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này.

Theo một phương án nữa, R^3 là heteroaryl có 6 cạnh vòng, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heterocyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S, trong đó heteroaryl có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này; tốt hơn nữa là heteroaryl nêu trên là pyridinyl hoặc pyrimidinyl.

Theo một phương án nữa, R^3 mang 1, 2 hoặc 3 nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau.

Theo một phương án nữa, R^b độc lập với nhau được chọn từ carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, naphtyl hoặc heterocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và trong đó phenyl và các nhóm heterocyclyl R^b nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh.

Theo một phương án nữa, các nhóm béo hoặc vòng R^b mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^c giống nhau hoặc khác nhau, mà, có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, được chọn từ halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy và C_1 - C_4 -haloalkoxy; tốt hơn nữa là R^b mang 1, 2 hoặc 3 nhóm R^c giống

nhau hoặc khác nhau.

Theo một phương án nữa, R^c , mà, có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, phenyl hoặc heteroxyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; trong đó các nhóm vòng R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh và có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^d giống nhau hoặc khác nhau như được xác định trong tài liệu này.

Theo một phương án nữa, hai gốc R^b mà được liên kết với các nguyên tử cạnh vòng liền kề của nhóm vòng R^3 tạo thành cùng với các nguyên tử cạnh vòng nêu trên một vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5, 6 hoặc 7 cạnh vòng, mà có thể là vòng cacbon hoặc vòng khác loại, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của vòng khác loại nóng chảy bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S.

Theo một phương án nữa, R^3 là $-CR^A=N-O-R^B$, trong đó R^A là amino, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, naphthyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và, trong đó phenyl và các nhóm heteroxyclyl R^A nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh, trong đó các nhóm béo hoặc vòng R^A có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau, mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy.

Theo một phương án nữa, R^3 là $-CR^A=N-O-R^B$, trong đó R^B là hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, phenyl, naphthyl hoặc het-

erocyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng, trong đó các nhóm béo hoặc vòng R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau, mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy.

Tốt hơn nữa là R^A và R^B , độc lập với nhau, là C_1 - C_4 -alkyl mà có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa halogen giống nhau hoặc khác nhau; cụ thể R^A và R^B là methyl.

Theo một phương án nữa, các nhóm béo hoặc vòng R^A và/hoặc R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau, tốt hơn nữa là chúng mang 0, 1 hoặc 3 nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau

Theo một phương án nữa, R^e , mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy.

Theo một phương án nữa, R^4 là $-C(=NOCH_3)-CONHCH_3$, $-C(=NOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-CONHCH_3$, $-N(OCH_3)-COOCH_3$, $-N(CH_3)-COOCH_3$ hoặc $-N(CH_2CH_3)-COOCH_3$

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-1 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-1 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là NH.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-2 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-2 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là NH.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-3 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-3 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là NH.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-4 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-4 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là NH.

Theo một phương án nữa, R^5 là C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy, tốt hơn nữa là C_1 - C_2 -alkyl hoặc C_1 - C_2 -alkoxy, thậm chí tốt hơn nữa là methyl, ethyl hoặc methoxy.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-4 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O và trong đó R^5 là methyl, ethyl hoặc methoxy.

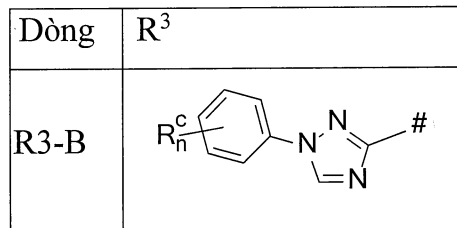
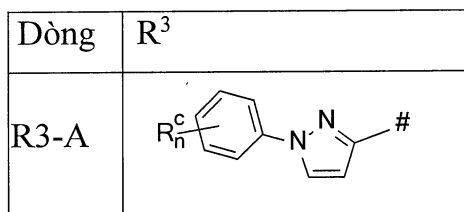
Theo một phương án nữa, R^4 là R4-5 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là O.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-5 như được xác định trong tài liệu này, trong đó X là NH.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-6 như được xác định trong tài liệu này.

Theo một phương án nữa, R^4 là R4-7 như được xác định trong tài liệu này.

Các phương án khác của sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó nhóm R^3 là một trong số các gốc từ R3-A đến R3-B sau đây, trong đó # biểu thị điểm liên kết với phân tử liên kết Y:



Các phương án được đặc biệt ưu tiên của sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó nhóm R^3 là một trong số các gốc từ R3-1 đến R3-195 sau đây, trong đó # biểu thị điểm liên kết với phân tử liên kết Y:

Bảng A.

Dòng	R ³
R3-1	
R3-2	
R3-3	
R3-4	
R3-5	
R3-6	
R3-7	
R3-8	
R3-9	

Dòng	R ³
R3-10	
R3-11	
R3-12	
R3-13	
R3-14	
R3-15	
R3-16	
R3-17	
R3-18	

Dòng	R ³
R3-19	
R3-20	
R3-21	
R3-22	
R3-23	
R3-24	
R3-25	
R3-26	
R3-27	
R3-28	

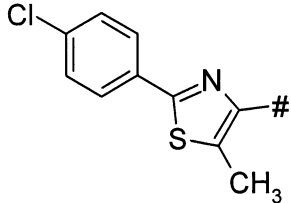
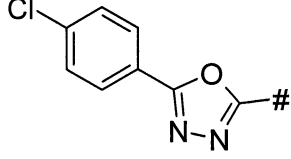
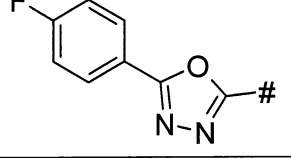
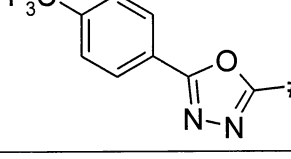
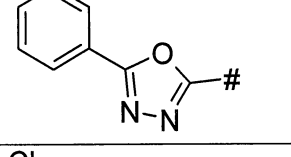
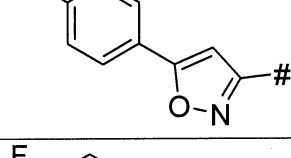
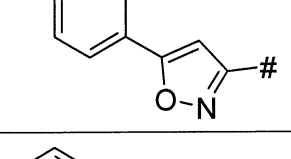
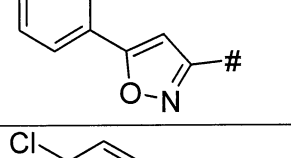
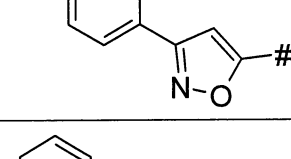
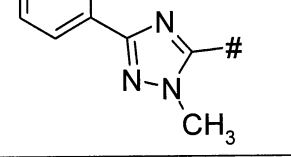
Dòng	R ³
R3-29	
R3-30	
R3-31	
R3-32	
R3-33	
R3-34	
R3-35	
R3-36	
R3-37	
R3-38	

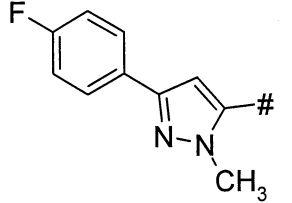
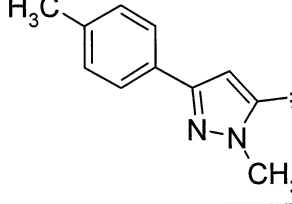
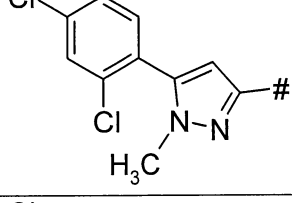
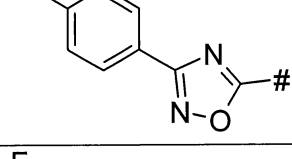
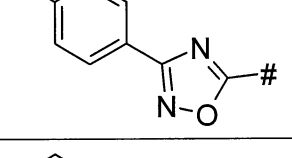
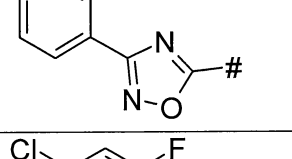
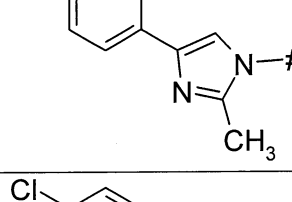
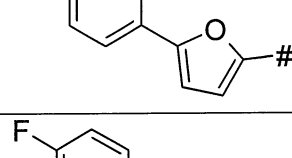
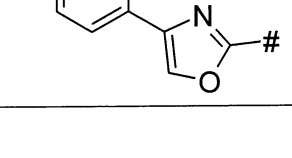
Dòng	R ³
R3-39	
R3-40	
R3-41	
R3-42	
R3-43	
R3-44	
R3-45	
R3-46	

Dòng	R ³
R3-47	
R3-48	
R3-49	
R3-50	
R3-51	
R3-52	
R3-53	
R3-54	

Dòng	R ³
R3-55	
R3-56	
R3-57	
R3-58	
R3-59	
R3-60	
R3-61	
R3-62	
R3-63	
R3-64	

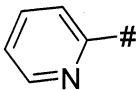
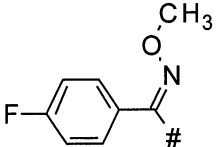
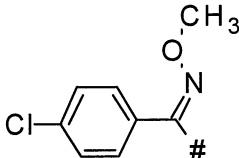
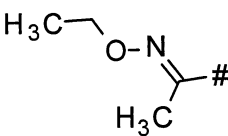
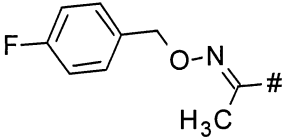
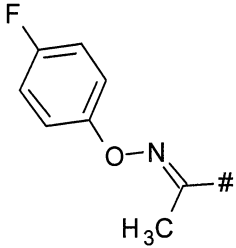
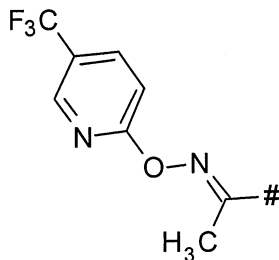
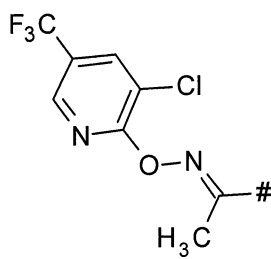
Dòng	R ³
R3-65	
R3-66	
R3-67	
R3-68	
R3-69	
R3-70	
R3-71	
R3-72	
R3-73	
R3-74	
R3-75	

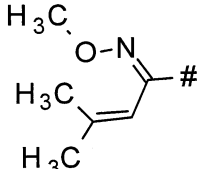
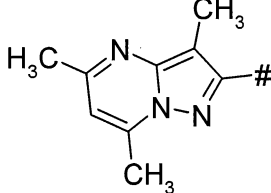
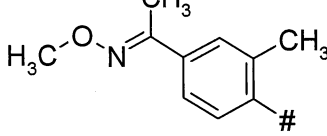
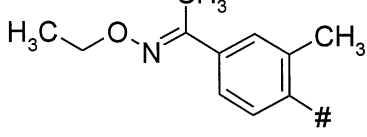
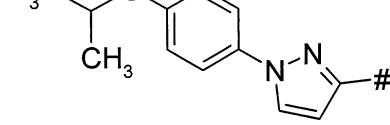
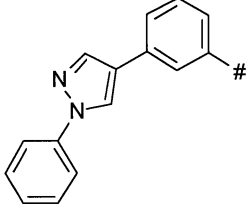
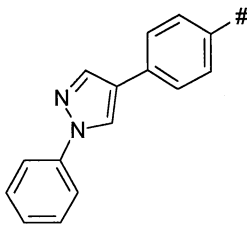
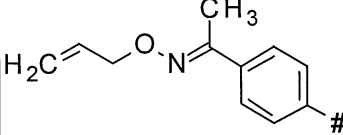
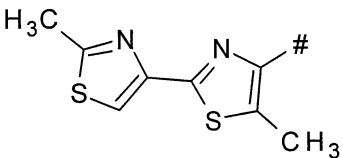
Dòng	R ³
R3-76	
R3-77	
R3-78	
R3-79	
R3-80	
R3-81	
R3-82	
R3-83	
R3-84	
R3-85	

Dòng	R ³
R3-86	
R3-87	
R3-88	
R3-89	
R3-90	
R3-91	
R3-92	
R3-93	
R3-94	

Dòng	R ³
R3-95	
R3-96	
R3-97	
R3-98	
R3-99	
R3-100	
R3-101	
R3-102	
R3-103	
R3-104	
R3-105	

Dòng	R ³
R3-106	
R3-107	
R3-108	
R3-109	
R3-110	
R3-111	
R3-112	
R3-113	
R3-114	
R3-115	
R3-116	

Dòng	R ³
R3-117	
R3-118	
R3-119	
R3-120	
R3-121	
R3-122	
R3-123	
R3-124	

Dòng	R ³
R3-125	
R3-126	
R3-127	
R3-128	
R3-129	
R3-130	
R3-131	
R3-132	
R3-133	

Dòng	R ³
R3-134	
R3-135	
R3-136	
R3-137	
R3-138	
R3-139	
R3-140	
R3-141	
R3-142	
R3-143	

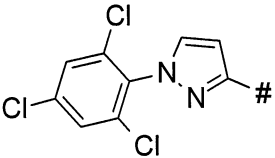
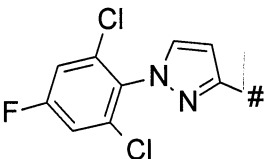
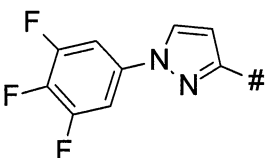
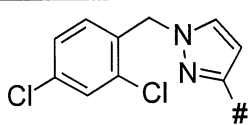
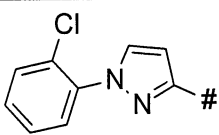
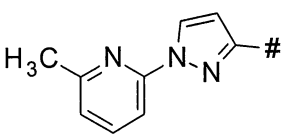
Dòng	R ³
R3-144	
R3-145	
R3-146	
R3-147	
R3-148	
R3-149	
R3-150	
R3-151	
R3-152	
R3-153	

Dòng	R ³
R3-154	
R3-155	
R3-156	
R3-157	
R3-158	
R3-159	
R3-160	
R3-161	
R3-162	

Dòng	R ³
R3-163	
R3-164	
R3-165	
R3-166	
R3-167	
R3-168	
R3-169	
R3-170	

Dòng	R ³
R3-171	
R3-172	
R3-173	
R3-174	
R3-175	
R3-176	
R3-177	
R3-178	
R3-179	

Dòng	R ³
R3-180	
R3-181	
R3-182	
R3-183	
R3-184	
R3-185	
R3-186	
R3-187	
R3-188	
R3-189	

Dòng	R ³
R3-190	
R3-191	
R3-192	
R3-193	
R3-194	
R3-195	

trong đó # biểu thị điểm liên kết với phân tử liên kết Y.

Các phương án được ưu tiên theo sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức I, trong đó nhóm R^3 là R3-A, cụ thể là R3-1 (1-(4-clophenyl)-pyrazol-3-yl).

Các hợp chất có công thức I và các chế phẩm theo sáng chế lần lượt là các thuốc diệt nấm. Chúng được phân biệt bởi hiệu quả vượt trội chống lại một phổ rộng các loại nấm gây bệnh trên cây, bao gồm nấm ở trong đất, mà đặc biệt bắt nguồn từ các nhóm Plasmodiophoromycetes, Peronosporomycetes (Oomycetes tổng hợp), Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes và Deuteromycetes (Fungi imperfecti tổng hợp). Một số hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có hiệu quả một cách hệ thống và có thể được sử dụng để bảo vệ cây trồng như thuốc diệt nấm trên lá, thuốc diệt nấm để xử lý hạt giống và thuốc diệt nấm ở đất trồng. Hơn nữa, chúng là thích hợp để kiểm soát nấm có hại, mà không kể những thứ khác, xuất hiện ở gỗ hoặc rễ của thực vật.

Các hợp chất có công thức I và các chế phẩm theo sáng chế là đặc biệt quan trọng trong việc kiểm soát các loại nấm gây bệnh trên cây trên các cây trồng khác nhau, như cây ngũ cốc, ví dụ, cây lúa mì, cây lúa mạch đen, cây lúa mạch, cây lai giữa cây lúa mì và cây lúa mạch đen, cây yến mạch hoặc cây lúa; cây củ cải đường, ví dụ, cây củ cải đường hoặc cây củ cải đường dùng cho chăn nuôi; trái cây, như quả có nhiều hạt, quả cứng hoặc quả mềm, ví dụ, quả táo, quả lê, quả mận, quả đào, quả hạnh, quả anh đào, quả dâu tây, quả ngấy, quả mâm xôi hoặc quả lý gai; cây thuộc loại đậu, như cây đậu lăng, cây đậu Hà Lan, cỏ linh lăng hoặc cây đậu tương; cây có dầu, như cây cải dầu, cây cải cay, cây ôliu, cây hướng dương, quả dừa, hạt cacao, cây thầu dầu, cây cọ dầu, lạc hoặc cây đậu tương; loại cây bầu bí, như cây bí, cây dưa chuột hoặc quả dưa hấu; cây lấy sợi, như cây bông, cây lanh, cây gai dầu hoặc cây đay; trái cây thuộc họ cam quýt, như quả cam, quả chanh, quả bưởi hoặc quả quýt; các loại rau, như rau cải bó xôi, rau diếp, măng tây, cải bắp, củ cà rốt, củ hành, cà chua, khoai tây, các loại cây bầu bí hoặc ớt ngọt; cây thuộc họ long nhãn, như quả bơ, cây quế hoặc long nhãn; cây làm năng lượng và vật liệu, như ngô, cây đậu tương, cây cải dầu, cây mía hoặc cây cọ dầu; ngô; cây thuốc lá; quả hạch; cây cà phê; cây chè; cây chuối; cây nho (cây nho trồng ở cao nguyên và nước nho, cây nho); cây hoa bia; vàng cỏ; lá ngọt (còn được gọi là Stevia); cây cao su tự nhiên hoặc cây cảnh và cây rừng, như hoa, cây bụi, cây lá rộng hoặc cây xanh trang trí, ví dụ, cây lá kim; và trên vật liệu

nhân giống cây, như hạt giống, và vật liệu thu hoạch của các cây này.

Tốt hơn là, các hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng lần lượt được sử dụng để kiểm soát vô số các loại nấm trên cây nông nghiệp, như cây khoai tây, cây củ cải đường, cây thuốc lá, cây lúa mì, cây lúa mạch đen, cây lúa mạch, cây yến mạch, cây lúa, cây ngô, cây bông, cây đậu tương, cây cải dầu, cây họ đậu, cây hướng dương, cây cà phê hoặc cây mía; trái cây; cây nho; cây trang trí; hoặc các loại rau như cây dưa chuột, cây cà chua, cây đậu hoặc cây bí.

Thuật ngữ "vật liệu nhân giống cây" được hiểu là tất cả các bộ phận có khả năng sinh sản của cây như hạt giống và vật liệu cây dinh dưỡng như cành giâm và củ (ví dụ, khoai tây), mà có thể được sử dụng để nhân cây. Vật liệu nhân giống cây bao gồm hạt giống, rễ cây, quả, củ, thân rễ, chồi, mầm và các bộ phận khác của cây, bao gồm cây giống con và cây con, mà được trồng lại sau khi nảy mầm hoặc sau khi chồi lên khỏi mặt đất. Các cây con này cũng có thể được bảo vệ trước khi trồng lại bằng cách xử lý toàn bộ hoặc một phần bằng cách ngâm hoặc tưới.

Tốt hơn là, xử lý các vật liệu nhân giống cây bằng các hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt, được sử dụng để kiểm soát vô số các loại nấm trên cây ngũ cốc, như cây lúa mì, cây lúa mạch đen, cây lúa mạch và cây yến mạch; cây lúa, cây ngô, cây bông và cây đậu tương.

Thuật ngữ "cây trồng" được hiểu là bao gồm các cây mà được biến đổi bằng cách gây giống, gây đột biến hoặc kỹ thuật di truyền bao gồm nhưng không giới hạn ở các sản phẩm nông nghiệp công nghệ sinh học trên thị trường hoặc đang phát triển (cf. cf. <http://cera-gmc.org/>, xem cơ sở dữ liệu cây trồng GM ở đây). Cây biến đổi gen là cây mà vật liệu di truyền được biến đổi bằng cách sử dụng kỹ thuật ADN tái tổ hợp mà dưới các trường hợp tự nhiên không thể thu được một cách dễ dàng bằng cách nhân giống chéo, đột biến hoặc tái tổ hợp tự nhiên. Điển hình là, một hoặc nhiều hơn một gen được kết hợp vào vật liệu di truyền của cây biến đổi gen để cải thiện các đặc tính nhất định của cây. Sự biến đổi gen này cũng bao gồm nhưng không giới hạn ở sự biến đổi protein đích sau dịch mã, oligo- hoặc polypeptit, ví dụ, bằng cách glycosyl hóa hoặc cộng polyme như các phân tử prenyl hóa, phân tử axetyl hóa hoặc phân tử farnesyl hóa hoặc các phân tử PEG.

Các hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt, là

đặc biệt thích hợp để kiểm soát các bệnh sau đây ở cây:

Albugo spp. (bệnh gỉ sắt màu trắng) trên các cây trang trí, rau (ví dụ, *A. candida*) và cây hướng dương (ví dụ, *A. tragopogonis*); *Alternaria* spp. (đốm lá *Alternaria*) trên rau, cây cải dầu (*A. brassicola* hoặc *brassicae*), cây củ cải đường (*A. tenuis*), trái cây, cây lúa, cây đậu tương, cây khoai tây (ví dụ, *A. solani* hoặc *A. alternata*), cây cà chua (ví dụ, *A. solani* hoặc *A. alternata*) và cây lúa mì; *Aphanomyces* spp. trên cây củ cải đường và rau; *Ascochyta* spp. trên cây ngũ cốc và rau, ví dụ *A. tritici* (bệnh loét cây) trên cây lúa mì và *A. hordei* trên cây lúa mạch; *Bipolaris* và *Drechslera* spp. (cấu trúc sinh sản của nấm: *Cochliobolus* spp.), ví dụ, bệnh tàn rụi lá ở miền Nam (*D. maydis*) hoặc bệnh tàn rụi lá ở miền Bắc (*B. zeicola*) trên cây ngô, ví dụ, bệnh mụn đốm (*B. sorokiniana*) trên cây ngũ cốc và ví dụ, *B. oryzae* trên cây lúa và các vàng cỏ; *Blumeria* (trước đây là *Erysiphe*) *graminis* (nấm mốc bột) trên cây ngũ cốc (ví dụ, trên cây lúa mì hoặc cây lúa mạch); *Botrytis cinerea* (cấu trúc sinh sản của nấm: *Botryotinia fuckeliana*: bệnh mốc xám) trên trái cây và quả mọng (ví dụ, quả dâu tây), rau (ví dụ, rau diếp, củ cà rốt, cần tây và bắp cải), cây cải dầu, hoa, cây nho, cây rừng và cây lúa mì; *Bremia lactucae* (bệnh nấm mốc sương ở đồi trọc) trên rau diếp; *Ceratocystis* (*Ophiostoma* tổng hợp) spp. (mục nát hoặc héo) trên cây lá rộng và cây xanh, ví dụ, *C. ulmi* (bệnh trên cây du Hà Lan) trên cây du; *Cercospora* spp. (bệnh đốm lá *Cercospora*) trên cây ngô (ví dụ, bệnh đốm lá xám: *C. zeae-maydis*), cây lúa, cây củ cải đường (ví dụ, *C. beticola*), cây mía, rau, cây cà phê, cây đậu tương (ví dụ, *C. sojae* hoặc *C. kikuchii*) và cây lúa; *Cladosporium* spp. trên cây cà chua (ví dụ, *C. fulvum*: đất mùn) và cây ngũ cốc, ví dụ, *C. herbarum* (bệnh tai đen) trên cây lúa mì; *Claviceps purpurea* (nấm cựa gà) trên cây ngũ cốc; *Cochliobolus* (ấu trùng thiếu đốt: *Helminthosporium* của *Bipolaris*) spp. (bệnh đốm lá) trên cây ngô (*C. carbonum*), cây ngũ cốc (ví dụ *C. sativus*, ấu trùng thiếu đốt: *B. sorokiniana*) và cây lúa (ví dụ, *C. miyabeanus*, ấu trùng thiếu đốt: *H. oryzae*); *Colletotrichum* (cấu trúc sinh sản của nấm: *Glomerella*) spp. (bệnh loét) trên cây bông (ví dụ, *C. gossypii*), cây ngô (ví dụ, *C. graminicola*: thân mục do bệnh loét), trái cây mềm, cây khoai tây (ví dụ, *C. coccodes*: bệnh đốm đen), đậu (ví dụ, *C. lindemuthianum*) và cây đậu tương (ví dụ, *C. truncatum* hoặc *C. gloeosporioides*); *Corticium* spp., ví dụ, *C. sasakii* (bệnh tàn rụi ở vỏ) trên cây lúa; *Corynespora cassiicola* (bệnh đốm lá) trên cây đậu tương và cây trang trí; *Cyloconium* spp., ví dụ, *C. oleaginum* trên cây ôliu; *Cylindrocarpon* spp. (ví dụ, bệnh

thối mục ở cây ăn quả hoặc bệnh gây mòn ở cây nho con, cấu trúc sinh sản của nấm: *Nectria* hoặc *Neonectria* spp.) trên cây ăn quả, cây nho (ví dụ, *C. liriodendri*, cấu trúc sinh sản của nấm: *Neonectria liriodendri*: bệnh rỗ đen) và cây trang trí; *Dematophora* (cấu trúc sinh sản của nấm: *Rosellinia*) necatrix (bệnh thối rửa rỗ và thân cây) trên cây đậu tương; *Diaporthe* spp., ví dụ, *D. phaseolorum* (bệnh úng nước) trên cây đậu tương; *Drechslera* (*Helminthosporium* tổng hợp, cấu trúc sinh sản của nấm: *Pyrenophora*) spp. trên cây ngô, cây ngũ cốc, như cây lúa mạch (ví dụ, *D. teres*, bệnh đốm lười) và cây lúa mì (ví dụ, *D. tritici-repentis*: bệnh đốm vỏ), cây lúa và vàng cỏ; Esca (bệnh chết dần các chồi cây, chứng ngập máu) trên cây nho, gây ra bởi *Formitiporia* (*Phellinus* tổng hợp) *punctata*, *F. mediterranea*, *Phaeomoniella chlamydospora* (ban đầu là *Phaeoacremonium chlamydosporum*), *Phaeoacremonium aleophilum* và/hoặc *Botryosphaeria obtusa*; *Elsinoe* spp. trên quả có nhiều hạt (*E. pyri*), quả mềm (*E. veneta*: bệnh loét) và cây nho (*E. ampelina*: bệnh loét); *Entyloma oryzae* (bệnh nấm than trên lá) trên cây lúa; *Epicoccum* spp. (bệnh nấm mốc đen) trên cây lúa mì; *Erysiphe* spp. (nấm mốc bột) trên cây củ cải đường (*E. betae*), rau (ví dụ, *E. pisi*), như loại cây bầu bí (ví dụ, *E. cichoracearum*), bắp cải, cây cải dầu (ví dụ, *E. cruciferarum*); *Eutypa lata* (bệnh thối mục *Eutypa* hoặc bệnh chết dần các chồi cây, ấu trùng thiếu đốt: *Cytosporina lata*, *Liberella blepharis* tổng hợp) trên cây ăn quả, cây nho và gỗ trang trí; *Exserohilum* (*Helminthosporium* tổng hợp) spp. trên cây ngô (ví dụ, *E. turcicum*); *Fusarium* (cấu trúc sinh sản của nấm: *Gibberella*) spp. (bệnh héo rũ, bệnh thối rửa rỗ hoặc thân cây) trên các cây khác nhau, như *F. graminearum* hoặc *F. culmorum* (bệnh thối rửa rỗ, bệnh nấm vảy hoặc bệnh tàn rụi đầu) trên cây ngũ cốc (ví dụ, cây lúa mì hoặc cây lúa mạch), *F. oxysporum* trên cây cà chua, *F. solani* trên cây đậu tương và *F. verticillioides* trên cây ngô; *Gaeumannomyces graminis* (nhiễm bệnh cả cây) trên cây ngũ cốc (ví dụ, cây lúa mì hoặc cây lúa mạch) và cây ngô; *Gibberella* spp. trên cây ngũ cốc (ví dụ, *G. zae*) và cây lúa (ví dụ, *G. fujikuroi*: bệnh Bakanae); *Glomerella cingulata* trên cây nho, quả có nhiều hạt và các cây khác và *G. gossypii* trên cây bông; phức chất nhuộm màu hạt trên cây lúa; *Guignardia bidwellii* (bệnh nấm làm cho cây có những điểm đen) trên cây nho; *Gymnosporangium* spp. trên cây thuộc họ hoa hồng và cây bách xù, ví dụ, *G. sabinae* (bệnh gỉ sắt) trên cây lê; *Helminthosporium* spp. (*Drechslera* tổng hợp, cấu trúc sinh sản của nấm: *Cochliobolus*) trên cây ngô, cây ngũ cốc và cây lúa; *Hemileia* spp., ví dụ, *H. vastatrix*

(bệnh gỉ sắt trên lá của cây cà phê) trên cây cà phê; *Isariopsis clavispora* (*Cladosporium vitis* tổng hợp) trên cây nho; *Macrophomina phaseolina* (*phaseoli* tổng hợp) (bệnh thối rữa rễ và thân cây) trên cây đậu tương và cây bông; *Microdochium* (*Fusarium* tổng hợp) *nivale* (bệnh mốc) trên cây ngũ cốc (ví dụ, cây lúa mì hoặc cây lúa mạch); *Microsphaera diffusa* (nấm mốc bột) trên cây đậu tương; *Monilinia* spp., ví dụ, *M. laxa*, *M. fructicola* và *M. fructigena* (bệnh tàn rụi trên hoa và cành con, bệnh mục nâu) trên quả cứng và các cây thuộc họ hoa hồng khác; *Mycosphaerella* spp. trên cây ngũ cốc, cây chuối, quả mềm và các loại cây thân củ, như ví dụ *M. graminicola* (ấu trùng thiếu đốt: *Septoria tritici*, bệnh mụn *Septoria*) trên cây lúa mì hoặc *M. fijiensis* (bệnh Sigatoka đen) trên cây chuối; *Peronospora* spp. (bệnh nấm mốc sương ở đôi trục) trên bắp cải (ví dụ, *P. brassicae*), cây cải dầu (ví dụ, *P. parasitica*), cây hành (ví dụ, *P. destructor*), thuốc lá (*P. tabacina*) và cây đậu tương (ví dụ, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* và *P. meibomia* (bệnh gỉ sắt ở đậu tương) trên cây đậu tương; *Phialophora* spp., ví dụ, trên cây nho (ví dụ, *P. tracheiphila* và *P. tetraspora*) và cây đậu tương (ví dụ, *P. gregata*: bệnh thối rữa thân cây); *Phoma lingam* (bệnh thối rữa rễ và thân cây) trên cây cải dầu và bắp cải và *P. betae* (bệnh thối rữa rễ, bệnh đốm lá và bệnh úng nước) trên cây củ cải đường; *Phomopsis* spp. trên hoa hướng dương, cây nho (ví dụ, *P. viticola*: bệnh đốm lá) và cây đậu tương (ví dụ, bệnh thối rữa thân cây: *P. phaseoli*, cấu trúc sinh sản của nấm: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (bệnh đốm sẫm) trên cây ngô; *Phytophthora* spp. (bệnh héo rũ, bệnh thối rữa rễ, lá, quả và thân cây) trên các cây khác nhau, như ớt chựa gà và các loại cây bầu bí (ví dụ, *P. capsici*), cây đậu tương (ví dụ, *P. megasperma*, *P. sojae* tổng hợp), cây khoai tây và cây cà chua (ví dụ, *P. infestans*: bệnh tàn rụi muộn) và các cây lá rộng (ví dụ, *P. ramorum*: bệnh chết đột ngột của cây sồi); *Plasmodiophora brassicae* (bệnh thối rễ) trên bắp cải, cây cải dầu, cây củ cải và các cây khác; *Plasmopara* spp., ví dụ, *P. viticola* (bệnh nấm mốc sương ở đôi trục trên cây nho) trên cây nho và *P. halstedii* trên cây hướng dương; *Podosphaera* spp. (nấm mốc bột) trên các cây thuộc họ hoa hồng, cây hoa bia, quả có nhiều hạt và quả mềm, ví dụ, *P. leucotricha* trên quả táo; *Polymyxa* spp., ví dụ, trên cây ngũ cốc, như cây lúa mạch và cây lúa mì (*P. graminis*) và cây củ cải đường (*P. betae*) và do đó truyền các bệnh virus; *Pseudocercospora herpotrichoides* (bệnh đốm mắt, cấu trúc sinh sản của nấm: *Tapesia yallundae*) trên cây ngũ cốc, ví dụ, cây lúa mì hoặc cây lúa mạch; *Pseudoperonospora* (bệnh nấm mốc sương ở đôi trục) trên các cây

khác nhau, ví dụ, *P. cubensis* trên các loại cây bầu bí hoặc *P. humili* trên cây hoa bia; *Pseudopezicula tracheiphila* (bệnh lửa đỏ, ấu trùng thiếu đốt: *Phialophora*) trên cây nho; *Puccinia* spp. (bệnh gỉ sắt) trên các cây khác nhau, ví dụ, *P. triticea* (bệnh rỉ nâu hoặc bệnh gỉ sắt trên lá), *P. striiformis* (bệnh vằn hoặc bệnh rỉ vàng), *P. hordei* (bệnh gỉ sắt ở cây lùn), *P. graminis* (bệnh rỉ trên thân cây hoặc bệnh rỉ đen) hoặc *P. recondita* (bệnh rỉ nâu hoặc bệnh rỉ trên lá) trên cây ngũ cốc, như, ví dụ, cây lúa mì, cây lúa mạch hoặc cây lúa mạch đen, *P. kuehnii* (bệnh rỉ cam) trên cây mía và *P. asparagi* trên măng tây; *Pyrenophora* (ấu trùng thiếu đốt: *Drechslera*) *tritici-repentis* (bệnh đốm vỏ) trên cây lúa mì hoặc *P. teres* (bệnh đốm vết hình lưới) trên cây lúa mạch; *Pyricularia* spp., ví dụ, *P. oryzae* (cấu trúc sinh sản của nấm: *Magnaporthe grisea*, bệnh khô héo trên cây lúa) trên cây lúa và *P. grisea* trên vàng cỏ và cây ngũ cốc; *Pythium* spp. (bệnh úng nước) trên vàng cỏ, cây lúa, cây ngô, cây lúa mì, cây bông, cây cải dầu, cây hướng dương, cây đậu tương, cây củ cải đường, rau và các loại cây khác (ví dụ, *P. ultimum* hoặc *P. aphanidermatum*); *Ramularia* spp., ví dụ, *R. collo-cygni* (bệnh đốm lá *Ramularia*, bệnh đốm lá sinh lý) trên cây lúa mạch và *R. beticola* trên cây củ cải đường; *Rhizoctonia* spp. trên cây bông, cây lúa, cây khoai tây, vàng cỏ, cây ngô, cây cải dầu, cây khoai tây, cây củ cải đường, rau và các loại cây khác, ví dụ, *R. solani* (bệnh thối rễ và thân cây) trên cây đậu tương, *R. solani* (bệnh tàn rụi vỏ) trên cây lúa hoặc *R. cerealis* (bệnh tàn rụi mùa xuân *Rhizoctonia*) trên cây lúa mì hoặc cây lúa mạch; *Rhizopus stolonifer* (bệnh nấm mốc đen, bệnh thối nhũn) trên quả dâu tây, củ cà rốt, bắp cải, cây nho và cây cà chua; *Rhynchosporium secalis* (vết bông) trên cây lúa mạch, cây lúa mạch đen và cây lai giữa cây lúa mì và cây lúa mạch đen; *Sarocladium oryzae* và *S. attenuatum* (bệnh thối rễ và vỏ) trên cây lúa; *Sclerotinia* spp. (bệnh thối rễ thân cây hoặc bệnh nấm mốc trắng) trên rau và các cây trồng, như cây cải dầu, cây hướng dương (ví dụ, *S. sclerotiorum*) và cây đậu tương (ví dụ, *S. rolfsii* hoặc *S. sclerotiorum*); *Septoria* spp. trên các loại cây khác nhau, ví dụ, *S. glycines* (bệnh đốm nâu) trên cây đậu tương, *S. tritici* (bệnh đốm vết *Septoria*) trên cây lúa mì và *S. (Stagonospora* tổng hợp) *nodorum* (bệnh đốm vết *Stagonospora*) trên cây ngũ cốc; *Uncinula* (*Erysiphe* tổng hợp) *necator* (nấm mốc bột, ấu trùng thiếu đốt: *Oidium tuckeri*) trên cây nho; *Setosphaeria* spp. (bệnh tàn rụi lá) trên cây ngô (ví dụ, *S. turcicum*, *Helminthosporium turcicum* tổng hợp) và vàng cỏ; *Sphacelotheca* spp. (bệnh than) trên cây ngô, (ví dụ, *S. reiliana*: bệnh than ở đầu), cây lúa miến và cây mía; *Sphaerotheca*

fuliginea (nấm mốc bột) trên các loại cây bầu bí; *Spongospora subterranea* (bệnh nấm vảy dạng bột) trên cây khoai tây và do đó truyền các bệnh virus; *Stagonospora* spp. trên cây ngũ cốc, ví dụ, *S. nodorum* (bệnh đốm vết *Stagonospora*, cấu trúc sinh sản của nấm: *Leptosphaeria* [*Phaeosphaeria* tổng hợp] *nodorum*) trên cây lúa mì; *Synchytrium endobioticum* trên cây khoai tây (bệnh bưou cây trên cây khoai tây); *Taphrina* spp., ví dụ, *T. deformans* (bệnh xoắn lá) trên cây đào và *T. pruni* (bệnh lỗ trên cây mận) trên cây mận; *Thielaviopsis* spp. (bệnh thối rễ rễ đen) trên thuốc lá, quả có nhiều hạt, rau, cây đậu tương và cây bông, ví dụ, *T. basicola* (*Chalara elegans* tổng hợp); *Tilletia* spp. (bệnh húc hoặc bệnh than có mùi hôi thối) trên cây ngũ cốc, như, ví dụ, *T. tritici* (*T. caries* tổng hợp, wheat bunt) và *T. controversa* (bệnh húc cây lùn) trên cây lúa mì; *Typhula incarnata* (bệnh nấm mốc dạng tuyết màu xám) trên cây lúa mạch hoặc cây lúa mì; *Urocystis* spp., ví dụ, *U. occulta* (bệnh than ở thân cây) trên cây lúa mạch đen; *Uromyces* spp. (bệnh gỉ sắt) trên rau, như đậu (ví dụ, *U. appendiculatus*, *U. phaseoli* tổng hợp) và cây củ cải đường (ví dụ, *U. betae*); *Ustilago* spp. (bệnh than xoắn) trên cây ngũ cốc (ví dụ, *U. nuda* và *U. avenae*), cây ngô (ví dụ, *U. maydis*: bệnh than trên cây ngô) và cây mía; *Venturia* spp. (bệnh nấm vảy) trên cây táo (ví dụ, *V. inaequalis*) và cây lê; và *Verticillium* spp. (bệnh héo rũ) trên các cây khác nhau, như trái cây và cây trang trí, cây nho, quả mềm, rau và cây trồng, ví dụ, *V. dahliae* trên quả dâu tây, cây cải dầu, cây khoai tây và cây cà chua.

Các hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt, có thể được sử dụng để cải thiện sức khỏe của cây. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp cải thiện sức khỏe của cây bằng cách xử lý cây, vật liệu nhân giống của nó và/hoặc nơi mà cây đang phát triển hoặc sẽ phát triển với một lượng hữu hiệu các hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt.

Thuật ngữ "sức khỏe của cây" được hiểu là tình trạng của cây và/hoặc các sản phẩm của nó mà được xác định bởi một vài chỉ số, một mình hoặc kết hợp với nhau, như năng suất (ví dụ, sinh khối tăng và/hoặc lượng các thành phần có giá trị lớn tăng), sự cường tráng của cây (ví dụ, sự tăng trưởng của cây được cải thiện và/hoặc lá xanh hơn ("hiệu ứng xanh")), chất lượng (ví dụ, lượng hoặc chế phẩm của các thành phần nhất định được cải thiện) và khả năng chịu được ứng suất phi sinh vật và/hoặc sinh vật. Các chỉ số được định nghĩa trên đây về tình trạng sức khỏe của cây có thể phụ thuộc lẫn nhau hoặc có thể xảy ra như là kết quả của chỉ số kia.

Các hợp chất có công thức I có thể có mặt trong các cải biến tinh thể khác nhau mà hoạt tính sinh học của chúng có thể khác nhau. Cũng như vậy, chúng là đối tượng của sáng chế.

Các hợp chất có công thức I được sử dụng theo cách thông thường hoặc dưới dạng các chế phẩm bằng cách xử lý nấm hoặc cây, vật liệu nhân giống của cây, như hạt giống, đất trồng, bề mặt, vật liệu hoặc phòng được bảo vệ khỏi sự tấn công của nấm với một lượng hữu hiệu có tác dụng diệt nấm của các chất hoạt tính. Việc sử dụng này có thể được thực hiện cả trước và sau khi cây, vật liệu nhân giống của cây, như hạt giống, đất trồng, bề mặt, vật liệu hoặc phòng bị nhiễm nấm.

Vật liệu nhân giống của cây có thể được xử lý bằng các hợp chất có công thức I theo cách thông thường hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức I có tác dụng phòng bệnh hoặc là khi hoặc là trước khi trồng cây hoặc cấy ghép cây.

Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm hóa nông chứa chất phụ trợ và ít nhất một hợp chất có công thức I theo sáng chế.

Chế phẩm hóa nông bao gồm một lượng hữu hiệu có tác dụng diệt nấm của hợp chất có công thức I. Thuật ngữ “lượng hữu hiệu” có nghĩa là lượng chế phẩm hoặc lượng hợp chất có công thức I mà đủ để kiểm soát nấm có hại trên cây trồng hoặc bảo vệ vật liệu và không làm ảnh hưởng đáng kể đến cây được xử lý. Lượng này có thể thay đổi trong một khoảng rộng và phụ thuộc vào nhiều yếu tố khác nhau, như loại nấm được kiểm soát, cây trồng hoặc vật liệu được xử lý, điều kiện khí hậu và hợp chất có công thức I cụ thể được sử dụng.

Các hợp chất có công thức I, N-oxit và các muối của chúng có thể được chuyển hóa thành các loại chế phẩm hóa nông thông thường, ví dụ, dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bụi, bột, bột nhão, hạt, vật ép, nang bao, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về các loại chế phẩm là huyền phù (ví dụ, SC, OD, FS), chất cô đặc nhũ tương (ví dụ, EC), nhũ tương (ví dụ, EW, EO, ES, ME), nang bao (ví dụ, CS, ZC), bột nhão, viên ngậm, bột hoặc bụi có thể thấm ướt (ví dụ, WP, SP, WS, DP, DS), vật ép (ví dụ, BR, TB, DT), hạt (ví dụ, WG, SG, GR, FG, GG, MG), các sản phẩm có tác dụng trừ sâu (ví dụ, LN), cũng như các chế phẩm dạng gel để xử lý các vật liệu nhân giống của cây như hạt giống (ví dụ,

GF). Các loại chế phẩm này và các loại chế phẩm khác nữa được xác định trong “Catalogue of pesticide formulation types and international coding system”, Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.

Các chế phẩm được điều chế theo cách đã biết, như được mô tả bởi Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; hoặc Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.

Các chất phụ trợ thích hợp là dung môi, chất mang lỏng, chất mang rắn hoặc chất đệm, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất nhũ tương, chất thấm ướt, chất phụ trợ, chất hòa tan, chất tăng thấm, chất keo coloít bảo vệ, chất tăng dính, chất cô đặc, chất làm ẩm, thuốc trừ rệp, chất hấp dẫn, chất kích thích nuôi dưỡng, chất tương thích, chất diệt khuẩn, chất chống đông, chất chống tạo bọt, chất nhuộm màu, chất dính và chất kết dính.

Các dung môi thích hợp và các chất mang lỏng là nước và dung môi hữu cơ, như phần chiết dầu khoáng có điểm sôi nằm trong khoảng từ trung bình đến cao, ví dụ, dầu lửa, dầu diezen; dầu có nguồn gốc thực vật hoặc động vật; hydrocacbon béo, vòng và thơm, ví dụ, toluen, parafin, tetrahydronaphtalen, naphtalen được alkyl hóa; rượu, ví dụ, etanol, propanol, butanol, rượu benzylic, xyclohexanol; glycol; DMSO; keton, ví dụ, xyclohexanon; este, ví dụ, lactat, carbonat, este của axit béo, gama-butyrolacton; axit béo; phosphonat; amin; amit, ví dụ, N-metylpyrrolidon, dimetyl amit của axit béo; và hỗn hợp của chúng.

Các chất mang rắn hoặc các chất đệm thích hợp là các khoáng thô, ví dụ, silicat, gel silic, bột talc, cao lanh, đá vôi, vôi, đá phấn, đất sét, dolomit, đất diatomit, bentonit, canxi sulfat, magiê sulfat, magiê oxit; polysacarit, ví dụ, xenluloza, tinh bột; phân bón, ví dụ, amoni sulfat, amoni phosphat, amoni nitrat, urê; các sản phẩm có nguồn gốc thực vật, ví dụ, bột ngũ cốc, bột vỏ cây, bột gỗ, bột vỏ quả hạch, và hỗn hợp của chúng.

Các chất hoạt động bề mặt thích hợp là các hợp chất có hoạt tính bề mặt, như các chất hoạt động bề mặt anion, cation, không ion và lưỡng tính, polyme khối, chất đa điện phân, và hỗn hợp của chúng. Các chất hoạt động bề mặt này có thể được sử dụng làm chất nhũ tương, chất phân tán, chất hòa tan, chất thấm ướt, chất tăng thấm, chất keo coloít bảo vệ, hoặc chất phụ trợ. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt được liệt kê trong

McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. hoặc North American Ed.).

Các chất hoạt động bề mặt anion thích hợp là các muối kiềm, kiềm thổ hoặc amoni của các sulfonat, sulfat, phosphat, carboxylat, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về các sulfonat là alkylarylsulfonat, diphenylsulfonat, alpha-olefin sulfonat, lignin sulfonat, sulfonat của các axit béo và dầu, sulfonat của alkylphenol được etoxy hóa, sulfonat của arylphenol được alkoxy hóa, sulfonat của naphtalen ngưng tụ, sulfonat của dodexyl- và tridexylbenzen, sulfonat của naphtalen và alkylnaphtalen, sulfosuxinat hoặc sulfosuxinamat. Ví dụ về các sulfat là sulfat của các axit béo và dầu, của alkylphenol được etoxy hóa, của rượu, của rượu được etoxy hóa, hoặc của các este của axit béo. Ví dụ về các phosphat là các este của phosphat. Ví dụ về các carboxylat là alkyl carboxylat, và rượu được carboxyl hóa hoặc alkylphenol etoxylat.

Các chất hoạt động bề mặt không ion thích hợp là các alkoxyat, các amit của axit béo được thế bởi N, amin oxit, este, các chất hoạt động bề mặt chứa đường, các chất hoạt động bề mặt polyme, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về các alkoxyat là các hợp chất như rượu, alkylphenol, amin, amit, arylphenol, axit béo hoặc este của axit béo mà được alkoxy hóa với từ 1 đến 50 đương lượng. Etylen oxit và/hoặc propylen oxit có thể được sử dụng để alkoxy hóa, tốt hơn là etylen oxit. Ví dụ về các amit của axit béo được thế bởi N là các gluxamit của axit béo hoặc alkanolamit của axit béo. Ví dụ về các este là các este của axit béo, glyxerol este hoặc monoglyxerit. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt chứa đường là sorbitan, sorbitan được etoxy hóa, este của sucroza và glucoza hoặc alkylpolyglucosit. Ví dụ về các chất hoạt động bề mặt polyme là home- hoặc copolyme của vinylpyrrolidon, rượu vinylic, hoặc vinylaxetat.

Các chất hoạt động bề mặt cation thích hợp là các chất hoạt động bề mặt bậc bốn, ví dụ, các hợp chất amoni bậc bốn có một hoặc hai gốc kỵ nước, hoặc các muối của các amin bậc nhất mạch dài. Các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính thích hợp là các alkylbetain và các imidazolin. Các polyme khối thích hợp là các polyme khối thuộc loại A-B hoặc A-B-A bao gồm các khối polyetylen oxit và polypropylen oxit, hoặc thuộc loại A-B-C bao gồm alkanol, polyetylen oxit và polypropylen oxit. Các chất đa điện phân thích hợp là các đa axit hoặc đa bazơ. Ví dụ về các đa axit là các muối kiềm của axit polyacryl-

ic hoặc các polyme lỗ tổ ong của đa axit. Ví dụ về các đa bazơ là các polyvinylamin hoặc polyetylenamin.

Các chất phụ trợ thích hợp là các hợp chất, mà bản thân chúng có ít hoặc thậm chí không có hoạt tính diệt loài gây hại, và cải thiện đặc tính sinh học của hợp chất có công thức I. Ví dụ là các chất hoạt động bề mặt, dầu khoáng hoặc dầu thực vật, và các chất phụ trợ khác. Các ví dụ khác được liệt kê trong Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Các chất cô đặc thích hợp là các polysacarit (ví dụ, gồm xanthan, carboxymetylxenluloza), đất sét vô cơ (được cải biến hữu cơ hoặc không được cải biến), polycarboxylat, và silicat.

Các chất diệt khuẩn thích hợp là các dẫn xuất của bronopol và isothiazolinon như alkylisothiazolinon và benzisothiazolinon.

Các chất chống đông thích hợp là etylen glycol, propylen glycol, urê và glyxerin.

Các chất chống tạo bọt thích hợp là silicon, rượu mạch dài, và muối của axit béo.

Các chất nhuộm màu thích hợp (ví dụ, nhuộm đỏ, xanh da trời, hoặc xanh lá cây) là các chất màu có độ hòa tan trong nước thấp và các chất nhuộm tan trong nước. Ví dụ là các chất nhuộm màu vô cơ (ví dụ, sắt oxit, titan oxit, sắt hexaxyanoferrat) và các chất nhuộm màu hữu cơ (ví dụ, các chất nhuộm màu alizarin-, azo- và phtaloxyanin).

Các chất dính hoặc các chất kết dính thích hợp là polyvinylpyrrolidon, polyvinylaxetat, rượu polyvinyl, polyacrylat, sáp sinh học hoặc tổng hợp, và xenluloza etc.

Ví dụ về các loại chế phẩm và cách điều chế chúng là:

i) Chất cô đặc tan trong nước (SL, LS)

Từ 10 đến 60% trọng lượng hợp chất có công thức I, và từ 5 đến 15% trọng lượng chất thấm ướt (ví dụ, rượu alkoxylat) được hòa tan trong nước và/hoặc trong dung môi tan trong nước (ví dụ, rượu) lên tới 100% trọng lượng. Hoạt chất hòa tan khi pha loãng với nước.

ii) Chất cô đặc có thể phân tán (DC)

Từ 5 đến 25% trọng lượng hợp chất có công thức I, và từ 1 đến 10% trọng lượng chất phân tán (ví dụ, polyvinylpyrrolidon) được hòa tan trong dung môi hữu cơ (ví dụ, xyclohexanon) lên tới 100% trọng lượng. Pha loãng với nước tạo ra thể phân tán.

iii) Chất cô đặc nhũ tương (EC)

Từ 15 đến 70% trọng lượng hợp chất có công thức I, và từ 5 đến 10% trọng lượng chất nhũ tương (ví dụ, canxi dodecylbenzensulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan trong dung môi hữu cơ không hòa tan trong nước (ví dụ, hydrocacbon thơm) lên tới 100% trọng lượng. Pha loãng với nước tạo ra thể nhũ tương.

iv) Thể nhũ tương (EW, EO, ES)

Từ 5 đến 40% trọng lượng hợp chất có công thức I, và từ 1 đến 10% trọng lượng chất nhũ tương (ví dụ, canxi dodecylbenzensulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan trong 20 đến 40% trọng lượng dung môi hữu cơ không hòa tan trong nước (ví dụ, hydrocacbon thơm). Hỗn hợp này được đưa vào nước lên tới 100% trọng lượng bằng máy tạo nhũ tương và tạo thành nhũ tương đồng nhất. Pha loãng với nước tạo ra thể nhũ tương.

v) Huyền phù (SC, OD, FS)

Trong máy nghiền bi được khuấy, từ 20 đến 60% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền có bổ sung từ 2 đến 10% trọng lượng chất phân tán và chất thấm ướt (ví dụ, natri lignosulfonat và rượu etoxylat), từ 0,1 đến 2% trọng lượng chất cô đặc (ví dụ, gôm xanthan) và nước lên tới 100% trọng lượng để tạo ra thể huyền phù của hoạt chất mịn. Pha loãng với nước tạo ra thể huyền phù ổn định của hoạt chất. Đối với chế phẩm loại FS, lên tới 40% trọng lượng chất kết dính (ví dụ, rượu polyvinyl) được bổ sung vào.

vi) Hạt phân tán trong nước và hạt hòa tan trong nước (WG, SG)

Từ 50 đến 80% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền mịn có bổ sung thêm chất phân tán và chất thấm ướt (ví dụ, natri lignosulfonat và rượu etoxylat) lên tới 100% trọng lượng và được điều chế thành hạt phân tán trong nước và hạt hòa tan trong nước bằng các thiết bị kỹ thuật (ví dụ, ép đùn, tháp phun, tầng sôi). Pha loãng với nước tạo ra thể phân tán ổn định hoặc dung dịch của hoạt chất.

vii) Bột phân tán trong nước và bột hòa tan trong nước (WP, SP, WS)

Từ 50 đến 80% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền trong máy nghiền roto-stato có bổ sung thêm từ 1 đến 5% trọng lượng chất phân tán (ví dụ, natri lignosulfonat), từ 1 đến 3% trọng lượng chất thấm ướt (ví dụ, rượu etoxylat) hoặc chất mang rắn (ví dụ, silicagel) lên tới 100% trọng lượng. Pha loãng với nước tạo ra thể phân tán ổn định hoặc dung dịch của hoạt chất.

viii) Gel (GW, GF)

Trong máy nghiền bi được khuấy, từ 5 đến 25% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền có bổ sung từ 3 đến 10% trọng lượng chất phân tán (ví dụ, natri lignosulfonat), từ 1 đến 5% trọng lượng chất cô đặc (ví dụ, carboxymethylxenluloza) và nước lên tới 100% trọng lượng để tạo ra huyền phù mịn của hoạt chất. Pha loãng với nước tạo ra huyền phù ổn định của hoạt chất.

iv) Vi nhũ tương (ME)

Từ 5 đến 20% trọng lượng hợp chất có công thức I được bổ sung vào từ 5 đến 30% trọng lượng hỗn hợp dung môi hữu cơ (ví dụ, dimethylamit của axit béo và xyclohexanon), từ 10 đến 25% trọng lượng hỗn hợp chất hoạt động bề mặt (ví dụ, rượu etoxylat và arylphenol etoxylat), và nước lên tới 100%. Hỗn hợp này được khuấy trong 1 giờ để tự động tạo ra vi nhũ tương ổn định về nhiệt động.

iv) Vi nang (CS)

Pha dầu chứa từ 5 đến 50% trọng lượng hợp chất có công thức I, từ 0 đến 40% trọng lượng dung môi hữu cơ hòa tan trong nước (ví dụ, hydrocacbon thơm), từ 2 đến 15% trọng lượng monome acrylic (ví dụ, metylmetacrylat, axit metacrylic và di- hoặc triacrylat) được phân tán vào dung dịch nước của chất keo coloít bảo vệ (ví dụ, rượu polyvinyl). Sự polyme hóa gốc được bắt đầu bởi chất khơi mào gốc dẫn đến sự tạo thành của các vi nang poly(meth)acrylat. Theo một cách khác, pha dầu chứa từ 5 đến 50% trọng lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế, từ 0 đến 40% trọng lượng dung môi hữu cơ hòa tan trong nước (ví dụ, hydrocacbon thơm), và monome isoxyanat (ví dụ, diphenylmeten-4,4'-diisoxyanatae) được phân tán vào dung dịch nước của chất keo coloít bảo vệ (ví dụ, rượu polyvinyl). Việc bổ sung polyamin (ví dụ, hexametylendiamin) dẫn

đến sự tạo thành của các vi nang polyurê. Các monome chiếm từ 1 đến 10% trọng lượng. % trọng lượng đề cập tới toàn bộ chế phẩm CS.

ix) Bột rắc bụi (DP, DS)

Từ 1 đến 10% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền mịn và được trộn kỹ với chất mang rắn lên tới 100% trọng lượng (ví dụ, cao lanh được nghiền mịn).

x) Hạt (GR, FG)

Từ 0,5 đến 30% trọng lượng hợp chất có công thức I được nghiền và được kết hợp với chất mang rắn (ví dụ, silicat) lên tới 100% trọng lượng. Sự nghiền hạt đạt được bằng cách ép đùn, sấy phun hoặc tăng sôi.

xi) Chất lỏng có thể tích cực thấp (UL)

Từ 1 đến 50% trọng lượng hợp chất có công thức I được hòa tan trong dung môi hữu cơ lên tới 100% trọng lượng (ví dụ, hydrocacbon thơm).

Các loại chế phẩm từ i) đến xi) có thể tùy ý chứa thêm các chất phụ trợ, như từ 0,1 đến 1% trọng lượng chất diệt khuẩn, từ 5 đến 15% trọng lượng chất chống đông, từ 0,1 đến 1% trọng lượng chất chống tạo bọt, và từ 0,1 đến 1% trọng lượng chất nhuộm màu.

Nói chung, các chế phẩm hóa nông chứa từ 0,01 đến 95%, tốt hơn là từ 0,1 đến 90%, và cụ thể là từ 0,5 đến 75% trọng lượng hoạt chất. Các hoạt chất được sử dụng với độ tinh khiết nằm trong khoảng từ 90% đến 100%, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 95% đến 100% (theo phổ NMR).

Dung dịch để xử lý hạt giống (LS), Huyền phù nhũ tương (SE), chất cô đặc có thể chảy ra (FS), bột để xử lý khô (DS), bột có thể phân tán trong nước để xử lý ở dạng huyền phù (WS), bột hòa tan trong nước (SS), nhũ tương (ES), chất cô đặc nhũ tương (EC) và gel (GF) thường được sử dụng cho mục đích xử lý các vật liệu nhân giống của cây, cụ thể là hạt giống. Các chế phẩm đang được đề cập đến tạo ra, sau khi pha loãng từ hai đến mười lần, nồng độ của hoạt chất nằm trong khoảng từ 0,01 đến 60% trọng lượng, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 40%, trong các chế phẩm dùng ngay. Có thể sử dụng trước hoặc trong khi gieo hạt. Phương pháp sử dụng hợp chất có công thức I và các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt, trên vật liệu nhân giống của cây, đặc biệt là hạt

giống bao gồm phương pháp bao, phủ, tạo viên, rắc bụi, tắm và cày vật liệu nhân giống. Tốt hơn là, hợp chất có công thức I hoặc các chế phẩm của chúng, theo thứ tự lần lượt, được sử dụng trên vật liệu nhân giống của cây bằng phương pháp sao cho không làm nảy mầm, ví dụ, bằng cách bao, tạo viên, phủ và rắc bụi hạt giống.

Khi được sử dụng để bảo vệ cây, lượng hoạt chất được sử dụng, phụ thuộc vào loại tác dụng mong muốn, nằm trong khoảng từ 0,001 đến 2kg/ha, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,005 đến 2kg/ha, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 0,05 đến 0,9kg/ha, và cụ thể là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 0,75kg/ha.

Khi xử lý vật liệu nhân giống của cây như hạt giống, ví dụ, bằng cách rắc bụi, phủ hoặc tắm hạt giống, nói chung là cần lượng hoạt chất nằm trong khoảng từ 0,1 đến 1000g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1 đến 1000g, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 1 đến 100g và tốt nhất là nằm trong khoảng từ 5 đến 100g/100kg vật liệu nhân giống của cây (tốt hơn là hạt giống).

Khi được sử dụng để bảo vệ vật liệu hoặc sản phẩm được bảo quản, lượng hoạt chất được sử dụng phụ thuộc vào loại bề mặt được sử dụng và tác dụng mong muốn. Lượng thường được sử dụng để bảo vệ vật liệu nằm trong khoảng từ 0,001g đến 2kg, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 0,005g đến 1kg hoạt chất/m³ vật liệu được xử lý.

Các loại dầu, chất thấm ướt, tá dược, phân bón, hoặc chất dinh dưỡng vi lượng, và các chất diệt loài gây hại khác (ví dụ, thuốc diệt cỏ, thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, chất điều chỉnh tăng trưởng, chất an toàn) có thể được bổ sung vào hoạt chất hoặc các chế phẩm chứa chúng như là hỗn hợp trộn sơ hoặc, nếu thích hợp không cho đến khi ngay trước khi sử dụng (trộn thùng). Các chất này có thể được trộn với các chế phẩm theo sáng chế với tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:100 đến 100:1, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1:10 đến 10:1.

Thông thường, người sử dụng dùng chế phẩm theo sáng chế từ thiết bị định liều trước, bình phun, bể phun, hoặc hệ thống tưới nước. Thông thường, chế phẩm hóa nông được tạo thành từ nước, chất đệm, và/hoặc các chất phụ trợ khác với nồng độ sử dụng mong muốn và do đó thu được chất lỏng để phun dùng ngay hoặc chế phẩm hóa nông theo sáng chế. Thông thường, từ 20 đến 2000l, tốt hơn là từ 50 đến 400l chất lỏng để phun dùng ngay/ha đất hữu ích trong nông nghiệp được sử dụng.

Theo một phương án, các thành phần riêng lẻ của chế phẩm theo sáng chế như các phần của kit hoặc các phần của hỗn hợp gồm hai thành phần hoặc ba thành phần có thể được trộn bởi người sử dụng trong bể phun và các chất phụ trợ khác có thể được bổ sung vào, nếu thích hợp.

Trộn các hợp chất có công thức I hoặc các chế phẩm chứa chúng dưới dạng sử dụng như các thuốc diệt nấm với các thuốc diệt nấm khác dẫn đến nhiều trường hợp mở rộng phổ hoạt tính diệt nấm hoặc ngăn chặn sự phát triển kháng thuốc diệt nấm. Hơn nữa, trong nhiều trường hợp, thu được tác dụng hiệp đồng.

Danh sách các hoạt chất sau đây, mà cùng với chúng, các hợp chất có công thức I có thể được sử dụng, nhằm để minh họa các cách kết hợp có thể nhưng không giới hạn chúng:

A) Chất ức chế hô hấp

- Chất ức chế của phức hệ III tại vị trí Q_o (ví dụ, strobilurin): azoxystrobin, coumetoxystrobin, coumoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fenaminstrobin, fenoxystrobin/flufenoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, trifloxystrobin, este metyl của axit 2-[2-(2,5-dimetyl-phenoxy-metyl)-phenyl]-3-metoxi-acrylic và 2-(2-(3-(2,6-diclophenyl)-1-metyl-alylideneaminooxymetyl)-phenyl)-2-metoxiimino-N-metyl-axetamit, pyribencarb, triclopyricarb/clodincarb, famoxadon, fenamidon;

- chất ức chế của phức hệ III tại vị trí Qi: xyazofamit, amisulbrom, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-axetoxy-4-metoxy-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(axetoxymetoxy)-4-metoxy-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-isobutoxycarbonyloxy-4-metoxy-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ylmetoxy)-4-metoxy-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat; (3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(3-hydroxy-4-metoxy-2-pyridinyl)carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-

dioxo-8-(phenylmetyl)-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat;

- chất ức chế của phức hệ II (ví dụ, carboxamit): benodanil, bixafen, boscalit, carboxin, fenfuram, fluopyram, flutolanil, fluxapyroxat, furametpyr, isopyrazam, mepronil, oxycarboxin, penflufen, penthiopyrat, sedaxan, tecloftalam, thifluzamit, N-(4'-triflometylthiobiphenyl-2-yl)-3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, N-(2-(1,3,3-trimetyl-butyl)-phenyl)-1,3-dimetyl-5-flo-1H-pyrazol-4-carboxamit, N-[9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(triflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(triflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(diflo-metyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 1,3,5-tri-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit;
- các chất ức chế hô hấp khác (ví dụ, phức chất I, chất không cặp đôi): diflumetorim, (5,8-difloquinazolin-4-yl)-{2-[2-flo-4-(4-triflometylpyridin-2-yloxy)-phenyl]-etyl}-amin; các dẫn xuất của nitrophenyl: binapacryl, dinobuton, dinocap, fluazinam; ferimzon; các hợp chất hữu cơ kim loại: muối fentin, như fentin-axetat, fentin clorua hoặc fentin hydroxit; ametoctradin; và silthiofam;

B) Chất ức chế tổng hợp sinh học sterol (các thuốc diệt nấm SBI)

- Chất ức chế demetylaza C14 (các thuốc diệt nấm DMI): triazol: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, xyproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, oxpoconazol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, -[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol; imidazol: imazalil, pefurazoat, procloraz, triflumizol; pyrimidin, pyridin và piperazin: fenarimol, nuarimol, pyrifenox, triforin;
- Chất ức chế delta14-reductaza: aldimorph, dodemorph, dodemorph-axetat,

fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, piperalin, spiroxamin;

- Chất ức chế của 3-keto reductaza: fenhexamit;

C) Chất ức chế tổng hợp của axit nucleic

- phenylamit hoặc các thuốc diệt nấm của axit amin axyl: benalaxyl, benalaxyl-M, kiralaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M (mefenoxam), ofurace, oxadixyl;
- các chất ức chế khác: hymexazol, othilidon, axit oxolinic, bupirimat, 5-floxytosin, 5-flo-2-(p-tolylmetoxy)pyrimidin-4-amin, 5-flo-2-(4-flophenylmetoxy)pyrimidin-4-amin;

D) Chất ức chế phân chia tế bào và xytoskeleton

- chất ức chế tubulin, như benzimidazol, thiophanat: benomyl, carbendazim, fuberidazol, thiabendazol, thiophanat-metyl; triazolopyrimidin: 5-clo-7-(4-metyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin
- các chất ức chế phân chia tế bào khác: dietofencarb, etaboxam, penxycuron, fluopicolit, zoxamit, metrafenon, pyriofenon;

E) Chất ức chế của axit amin và tổng hợp protein

- chất ức chế tổng hợp methionin (anilino-pyrimidin): xyprodinil, mepanipyrin, pyrimethanil;
- chất ức chế tổng hợp protein: blastixidin-S, kasugamycin, kasugamycin hydroclorua-hydrat, mildiomyxin, streptomycin, oxytetracyclin, polyoxin, validamycin A;

F) Chất ức chế tải nạp tín hiệu

- MAP / chất ức chế histidin kinaza: floimit, iprodion, proxymidon, vinclozolin, fenciclonil, fludioxonil;
- chất ức chế protein G: quinoxyfen;

G) Chất ức chế tổng hợp lipid và màng

- Chất ức chế tổng hợp phospholipit: edifenphos, iprobenfos, pyrazophos, isoprothiolan;

- Peroxy hóa lipid: dicloran, quintozen, tecnazen, tolclofos-metyl, biphenyl, cloneb, etridiazol;
- tổng hợp sinh học phospholipit và kết tủa thành tế bào: dimetomorph, flumorph, mandipropamit, pyrimorph, benthiavalicarb, iprovalicarb, valifenalat và este của axit N-(1-(1-(4-xyano-phenyl)etansulfonyl)-but-2-yl) carbamic-(4-flophenyl);
- các hợp chất ảnh hưởng đến độ thấm màng tế bào và các axit béo: propamocarb, propamocarb-hydroclorit;
- các chất ức chế hydrolaza amit của axit béo: 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon;

H) Các chất ức chế có tác dụng ở nhiều vị trí

- các hoạt chất vô cơ: hỗn hợp Bordeaux, đồng axetat, đồng hydroxit, đồng oxyclorea, đồng bazơ sulfat, lưu huỳnh;
- thio- và dithiocarbamat: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram;
- các hợp chất clo hữu cơ (ví dụ, phtalimit, sulfamit, clonitril): anilazin, clothalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanit, diclophen, flusulfamit, hexaclobenzen, pentaclophenol và các muối của nó, phtalit, tolylfluanit, N-(4-clo-2-nitro-phenyl)-N-etyl-4-metyl-benzensulfonamit;
- guanidin và các hợp chất khác: guanidin, dodin, bazơ không chứa dodin, guazatin, guazatin-axetat, iminoctadin, iminoctadin-triaxetat, iminoctadin-tris(albesilat), dithianon, 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraon;

I) Các chất ức chế tổng hợp thành tế bào

- các chất ức chế tổng hợp glucan: validamycin, polyoxin B; các chất ức chế tổng hợp melanin: pyroquilon, trixylazol, carpropamit, dixyclomet, fenoxanil;

J) Tác nhân gây cảm ứng bảo vệ cây

- axibenzolar-S-metyl, probenazol, isotianil, tiadinil, prohexadion-canxi; phosphonat:

fosetyl, fosetyl-nhôm, axit phosphorơ và các muối của nó;

K) Tác dụng chưa biết

- bronopol, chinomethionat, xyflufenamit, xymoxanil, dazomet, debacarb, diclo-mezin, difenzoquat, difenzoquat-metylsulfat, diphenylamin, fenpyrazamin, flumetover, flusulfamit, flutianil, methasulfocarb, nitrapyrin, nitrothal-isopropyl, oxin-đồng, proquinazit, tebufloquin, tecloftalam, triazoxit, 2-butoxy-6-iodo-3-propylchromen-4-on, N-(xyclopropylmetoxyimino-(6-diflo-metoxy-2,3-diflo-phenyl)-metyl)-2-phenyl axetamit, N'-(4-(4-clo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(4-(4-flo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(2-metyl-5-triflometyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(5-diflometyl-2-metyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-carboxylic metyl-(1,2,3,4-tetrahydro-naphtalen-1-yl)-amit, axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-carboxylic metyl-(R)-1,2,3,4-tetrahydro-naphtalen-1-yl-amit, 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, este của axit metoxy-axetic 6-tert-butyl-8-flo-2,3-dimetyl-quinolin-4-yl, N-Metyl-2-{1-[(5-metyl-3-triflometyl-1H-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphtalen-1-yl]-4-thiazolcarboxamit, 3-[5-(4-metylphenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin, 3-[5-(4-clo-phenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin (pyrisoxazol), amit của axit N-(6-metoxy-pyridin-3-yl) xyclopropancarboxylic, 5-clo-1-(4,6-dimetoxi-pyrimidin-2-yl)-2-metyl-1H-benzoimidazol, 2-(4-clo-phenyl)-N-[4-(3,4-dimetoxi-phenyl)-isoxazol-5-yl]-2-prop-2-ynyloxy-axetamit;

L) Các chất kiểm soát sinh học có tác dụng chống nấm, các chất hoạt hóa sinh học ở cây: *Ampelomyces quisqualis* (ví dụ, AQ 10[®] của Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Germany), *Aspergillus flavus* (ví dụ, AFLAGUARD[®] của Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (ví dụ, BOTECTOR[®] của bio-ferm GmbH, Germany), *Bacillus pumilus* (ví dụ, NRRL Accession No. B-30087 in SONATA[®] và BALLAD[®] Plus của AgraQuest Inc., USA), *Bacillus subtilis* (ví dụ, isolate NRRL-Nr. B-21661 in RHAPSODY[®],

SERENADE® MAX và SERENADE® ASO của AgraQuest Inc., USA), *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (ví dụ, TAEGRO® của Novozyme Biologicals, Inc., USA), *Candida oleophila* I-82 (ví dụ, ASPIRE® của Ecogen Inc., USA), *Candida saitoana* (ví dụ, BIOCURE® (trong hỗn hợp với lysozym) và BIOCOAT® của Micro Flo Company, USA (BASF SE) và Arysta), Chitosan (ví dụ, ARMOUR-ZEN của BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea* f. *catenulata*, cũng được gọi là *Gliocladium catenulatum* (ví dụ, isolate J1446: PRESTOP® của Verdera, Finland), *Coniothyrium minitans* (ví dụ, CONTANS® của Prophyta, Germany), *Cryphonectria parasitica* (ví dụ, *Endothia parasitica* của CNICM, France), *Cryptococcus albidus* (ví dụ, YIELD PLUS® của Anchor Bio-Technologies, South Africa), *Fusarium oxysporum* (ví dụ, BIOFOX® của S.I.A.P.A., Italy, FUSACLEAN® của Natural Plant Protection, France), *Metschnikowia fructicola* (ví dụ, SHEMER® của Agrogreen, Israel), *Microdochium dimerum* (ví dụ, ANTIBOT® của Agrauxine, France), *Phlebiopsis gigantea* (ví dụ, ROTSOP® của Verdera, Finland), *Pseudozyma flocculosa* (ví dụ, SPORODEX® của Plant Products Co. Ltd., Canada), *Pythium oligandrum* DV74 (ví dụ, POLYVERSUM® của Remeslo SSRO, Biopreparaty, Czech Rep.), *Reynoutria sachlinensis* (ví dụ, REGALIA® của Marrone BioInnovations, USA), *Talaromyces flavus* V117b (ví dụ, PROTUS® của Prophyta, Germany), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (ví dụ, ECO-HOPE® của Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japan), *T. atroviride* LC52 (ví dụ, SENTINEL® của Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (ví dụ, PLANTSHIELD® của Firma BioWorks Inc., USA), *T. harzianum* TH 35 (ví dụ, ROOT PRO® của Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (ví dụ, TRICHODEX® và TRICHODERMA 2000® của Mycontrol Ltd., Israel và Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* và *T. viride* (ví dụ, TRICHOPEL của Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 và *T. viride* ICC080 (ví dụ, REMEDIER® WP của Isagro Ricerca, Italy), *T. polysporum* và *T. harzianum* (ví dụ, BINAB® của BINAB Bio-Innovation AB, Sweden), *T. stromaticum* (ví dụ, TRICOVAB® của C.E.P.L.A.C., Brazil), *T. virens* GL-21 (ví dụ, SOILGARD® của Certis LLC, USA), *T. viride* (ví dụ, TRIECO® của Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIO-CURE® F của T. Stanes & Co. Ltd., Indien), *T. viride* TV1 (ví dụ, *T. viride* TV1 của Agribiotec srl, Italy), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (ví dụ, BOTRY-ZEN® của Botry-Zen Ltd, NZ);

M) Các chất điều chỉnh tăng trưởng

axit abscisic, amidoclo, anxymidol, 6-benzylaminopurin, brassinolit, butralin, clomequat (clomequat clorua), colin clorua, xyclanilit, daminozit, dikegulac, dimethipin, 2,6-dimethylpuridin, etephon, flumetralin, flurprimidol, fluthiaxet, forclofenuron, axit giberelic, inabenfit, axit indol-3-axetic, hydrazit maleic, mefluidit, mepiquat (mepiquat clorua), axit naphthalenaxetic, N-6-benzyladenin, paclobutrazol, prohexadion (prohexadion-canxi), prohydrojasmon, thidiazuron, triapenthenol, tributyl phosphorotrithioat, axit 2,3,5-tri-iodobenzoic, trinexapac-etyl và uniconazol;

N) Thuốc diệt cỏ

- axetamit: axetoclo, alaclo, butaclo, dimetaclo, dimetenamit, flufenaxet, mefenaxet, metolaclo, metazaclo, napropamit, naproanilit, pethoxamit, pretilaclo, propaclo, thenylclo;
- các dẫn xuất của axit amin: bilanafos, glyphosat, glufosinat, sulfosat;
- aryloxyphenoxypropionat: clodinafop, xyhalofop-butyl, fenoxaprop, fluazifop, haloxyfop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P-tefuryl;
- Bipyridyl: diquat, paraquat;
- (thio)carbamat: asulam, butylat, carbetamit, desmedipham, dimepiperat, eptam (EPTC), esprocarb, molinat, orbencarb, phenmedipham, prosulfocarb, pyributicarb, thiobencarb, trialat;
- xyclohexandion: butroxydim, clethodim, xycloxydim, profoxydim, setoxydim, tepraloxym, tralkoxydim;
- dinitroanilin: benfluralin, ethalfluralin, oryzalin, pendimethalin, prodiamin, trifluralin;
- ete diphenyl: axiflofen, aclonifen, bifenox, diclofop, etoxyfen, fomesafen, lactofen, oxyflofen;
- hydroxybenzonitril: bomoxynil, diclobenil, ioxynil;
- imidazolinon: imazamethabenz, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazethapyr;

- axit axetic phenoxy: clomeprop, axit 2,4-diclophenoxyaxetic (2,4-D), 2,4-DB, dicloprop, MCPA, MCPA-thioethyl, MCPB, Mecoprop;
- pyrazin: cloidazon, flufenpyr-ethyl, fluthiaxet, norflurazon, pyridat;
- pyridin: aminopyralit, clopyralit, diflufenican, dithiopyr, fluridon, fluroxypyr, picloram, picolinafen, thiazopyr;
- sulfonyl urê: amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, cloimuron-ethyl, closulfuron, xinosulfuron, xyclosulfamuron, etoxysulfuron, flazasulfuron, fluxetosulfuron, flupyr-sulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron, iodosulfuron, mesosulfuron, metazosulfuron, metsulfuron-metyl, nicosulfuron, oxasulfuron, primisulfuron, prosulfuron, pyrazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron, thifensulfuron, triasulfuron, tribenuron, trifloxysulfuron, triflusulfuron, tritosulfuron, 1-((2-clo-6-propyl-imidazo[1,2-b]pyridazin-3-yl)sulfonyl)-3-(4,6-dimetoxy-pyrimidin-2-yl)urê;
- triazin: ametryn, atrazin, xyanazin, dimethametryn, ethiozin, hexazinon, metamitron, metribuzin, prometryn, simazin, terbuthylazin, terbutryn, triaziflam;
- urê: clotoluron, daimuron, diuron, flometuron, isoproturon, linuron, metha-benzthiazuron, tebuthiuron;
- các chất ức chế axetolactat synthaza khác: bispyribac-natri, cloransulam-metyl, diclosulam, florasulam, flucarbazon, flumetsulam, metosulam, ortho-sulfamuron, penoxsulam, propoxycarbazon, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyriftalit, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyriithiobac, pyroxasulfon, pyroxsulam;
- các hợp chất khác: amicarbazon, aminotriazol, anilofos, beflubutamit, benazolin, bencarbazon, benfluresat, benzofenap, bentazon, benzobixyclon, bixyclopyron, bromaxil, bromobutit, butafenaxil, butamifos, cafenstrol, carfentrazon, xinidon-ethyl, clothal, xinmetylin, clomazon, xumyluron, xyprosulfamit, dicamba, difenzoquat, diflufenzopyr, *Drechslera monoceras*, endothal, etofumesat, etobenzanit, fenoxasulfon, fentrazamit, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, flupoxam, flocloidon, flurtamon, indanofan, isoxaben, isoxaflutol, lenaxil, propanil, propyzamit, quinclozac, quinmerac, mesotrion, metyl axit arsonic, naptalam, oxadiargyl, oxadiazon, oxaziclomefon, pentoxazon, pinoxaden,

pyraclozil, pyraflufen-etyl, pyrasulfotol, pyrazoxyfen, pyrazolynat, quinoclamín, saflufenaxil, sulcotrion, sulfentrazon, terbaxil, tefuryltrion, tembotrion, thiencarbazon, topramezon, este etyl của axit (3-[2-clo-4-flo-5-(3-metyl-2,6-dioxo-4-triflometyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-phenoxy]-pyridin-2-yloxy)-acetic, este metyl của axit 6-amino-5-clo-2-xyclopropyl-pyrimidin-4-carboxylic, axit 6-clo-3-(2-xyclopropyl-6-metyl-phenoxy)-pyridazin-4-ol, 4-amino-3-clo-6-(4-clo-phenyl)-5-flo-pyridin-2-carboxylic, este metyl của axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxi-phenyl)-pyridin-2-carboxylic, và este metyl của axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-3-dimetilamino-2-flo-phenyl)-pyridin-2-carboxylic.

O) Thuốc trừ sâu

- (thio)phosphat hữu cơ: axephat, azamethiphos, azinphos-metyl, clopyrifos, clopyrifos-metyl, clofenvinphos, diazinon, diclofos, dicrotophos, dimetoat, disulfoton, ethion, fenitrothion, fenthion, isoxathion, malathion, methamidophos, methidathion, metyl-parathion, mevinphos, monocrotophos, oxydemeton-metyl, paraoxon, parathion, phentoat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phorat, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, prothiofos, sulprophos, tetraclovinphos, terbufos, triazophos, triclofon;
- carbamat: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, fenoxycarb, furathiocarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamat;
- pyrethroid: alethrin, bifenthrin, xyfluthrin, xyhalothrin, xyphenothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, beta-xypermethrin, zeta-xypermethrin, deltamethrin, esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, imiprothrin, lambda-xyhalothrin, permethrin, pralethrin, pyrethrin I và II, resmethrin, silafluofen, tau-fluvalinat, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, profluthrin, dimefluthrin;
- chất điều chỉnh sự tăng trưởng của côn trùng: a) chất ức chế tổng hợp kitin: benzoylurê: cloflazuron, xyramazin, diflubenzuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazol, clofentazin; b) chất đối kháng ecdyson: halofenozit, metoxyfenozit, tebufenozit, azadirachtin; c) juvenoit: pyriproxyfen, methopren, fenoxycarb; d) chất ức chế tổng hợp sinh học lipid: spiroticlofen, spiromesifen,

spirotetramat;

- các hợp chất cơ chủ vận/đối kháng thụ thể nicotin: clothianidin, dinotefuran, flupyradifuron, imidacloprit, thiamethoxam, nitenpyram, axetamiprit, thiacloprit, 1-2-clo-thiazol-5-ylmetyl)-2-nitrimino-3,5-dimetyl-[1,3,5]triazinan;
- các hợp chất đối kháng GABA: endosulfan, ethiprol, fipronil, vaniliprol, pyrafluprol, pyriprol, amit của axit 5-amino-1-(2,6-diclo-4-metyl-phenyl)-4-sulfinamoyl-1H-pyrazol-3-carbothioic;
- thuốc trừ sâu lacton macrocyclic: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad, spinetoram;
- thuốc diệt ve bét chứa chất ức chế vận chuyển electron mitochondrial I (METI): fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenerim;
- các hợp chất METI II và III: axequinoxyl, fluaxyprim, hydrametylnon;
- hợp chất không cặp đôi: clofenapyr;
- chất ức chế phosphoryl hóa oxy hóa: xyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxit, propargit;
- các hợp chất phá vỡ sự rụng lông: cryomazin;
- các chất ức chế oxidaza chức năng hỗn hợp: piperonyl butoxit;
- khối có rãnh natri: indoxacarb, metaflumizon;
- các hợp chất khác: benclonthiaz, bifenazat, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozin, lưu huỳnh, thioxycclam, flubendiamit, cloantraniliprol, xyazypyr (HGW86), xyenopyrafen, flupyrzofos, xyflumetofen, amidoflumet, imixyafos, bistrifluron, và pyrifluquinazon.

Hơn nữa, sáng chế đề cập đến các chế phẩm hóa nông chứa hỗn hợp của ít nhất một hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất nữa hữu ích để bảo vệ cây, ví dụ, được chọn từ các nhóm A) đến O) (thành phần 2), cụ thể là một thuốc diệt nấm nữa, ví dụ, một hoặc nhiều hơn một thuốc diệt nấm từ các nhóm A) đến L), như được mô tả trên đây, và nếu muốn một dung môi hoặc chất mang rắn thích hợp. Các hợp

chất này được đặc biệt quan tâm, do nhiều hợp chất trong số chúng với cùng một tỷ lệ sử dụng có hiệu quả chống lại nấm có hại cao hơn. Hơn nữa, diệt nấm có hại bằng hỗn hợp chứa các hợp chất có công thức I và ít nhất một thuốc diệt nấm từ các nhóm A) đến L), như được mô tả trên đây, hiệu quả hơn diệt các loại nấm này bằng các hợp chất riêng lẻ có công thức I hoặc các thuốc diệt nấm riêng lẻ từ các nhóm A) đến L). Bằng cách sử dụng các hợp chất có công thức I cùng với ít nhất một hoạt chất từ các nhóm A) đến O) có thể đạt được tác dụng hiệp đồng, tức là sau đó đạt được sự tổng hợp đơn giản hơn của các tác dụng riêng lẻ (hỗn hợp hiệp đồng).

Điều này có thể đạt được bằng cách sử dụng các hợp chất có công thức I và đồng thời ít nhất một hoạt chất nữa, hoặc là kết hợp (ví dụ, như trộn thùng) hoặc là riêng biệt, hoặc là lần lượt, trong đó khoảng thời gian giữa các lần sử dụng riêng lẻ được chọn lọc để đảm bảo rằng hoạt chất được sử dụng trước tiên vẫn xuất hiện tại điểm tác dụng với một lượng hữu hiệu tại thời điểm sử dụng (các) hoạt chất khác. Thứ tự sử dụng là không cần thiết đối với cách hoạt động của sáng chế.

Ở hỗn hợp hai thành phần, tức là các chế phẩm theo sáng chế chứa một hợp chất có công thức I (thành phần 1) và một hoạt chất khác (thành phần 2), ví dụ, một hoạt chất từ các nhóm A) đến O), tỷ lệ trọng lượng của thành phần 1 và thành phần 2 thường phụ thuộc vào các đặc tính của hoạt chất được sử dụng, thông thường nó nằm trong khoảng từ 1:100 đến 100:1, thường là nằm trong khoảng từ 1:50 đến 50:1, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1:20 đến 20:1, tốt hơn nữa là nằm trong khoảng từ 1:10 đến 10:1 và cụ thể là nằm trong khoảng từ 1:3 đến 3:1.

Ở hỗn hợp ba thành phần, tức là các chế phẩm theo sáng chế chứa một hợp chất có công thức I (thành phần 1) và hoạt chất thứ nhất khác (thành phần 2) và hoạt chất thứ hai khác (thành phần 3), ví dụ, hai hoạt chất từ các nhóm từ A) đến O), tỷ lệ trọng lượng của thành phần 1 và thành phần 2 phụ thuộc vào các đặc tính của hoạt chất được sử dụng, tốt hơn là nó nằm trong khoảng từ 1:50 đến 50:1 và cụ thể là nằm trong khoảng từ 1:10 đến 10:1, và tốt hơn là tỷ lệ trọng lượng của thành phần 1 và thành phần 3 nằm trong khoảng từ 1:50 đến 50:1 và cụ thể là nằm trong khoảng từ 1:10 đến 10:1.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm A) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ azoxystrobin,

dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metyl, oryastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, trifloxystrobin; famoxadon, fenamidon; bixafen, boscalid, fluopyram, fluxapyroxad, isopyrazam, penflufen, penthiopyrad, sedaxan; ametocetradin, xyazofamid, fluazinam, muối fentin, như fentin axetat.

Ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm B) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ xyproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, prothioconazol, triadimefon, triadimenol, tebuconazol, tetraconazol, triticonazol, procloaz, fenarimol, triforin; dodemorph, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamin; fenhexamid.

Ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm C) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ metalaxyl, (metalaxyl-M) mefenoxam, ofurace.

Ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm D) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ benomyl, carbendazim, thiophanat-metyl, ethaboxam, fluopicolit, zoxamit, metrafenon, pyriofenon.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm E) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ xyprodinil, mepanipyrim, pyrimethanil.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm F) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ iprodion, fludioxonil, vinclozolin, quinoxyfen.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm G) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, benthiavalicarb, mandipropamid, propamocarb.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm H) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ đồng axetat, đồng hydroxit, đồng oxyclorea, đồng sulfat, lưu huỳnh, mancozeb, metiram, propineb, thiram, captafol, folpet, clothalonil, diclofluanid, dithianon.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm I) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ carpropamid và fenoxanil.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm J) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ axibenzolar-S-methyl, probenazol, tiadinil, fosetyl, fosetyl-nhôm, H_3PO_3 và muối của chúng.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm K) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ xymoxanil, proquinazid và *N*-metyl-2-{1-[(5-metyl-3-triflometyl-1H-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-*N*-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphtalen-1-yl]-4-thiazolcarboxamit.

Cũng ưu tiên hỗn hợp chứa hợp chất có công thức I (thành phần 1) và ít nhất một hoạt chất được chọn từ nhóm L) (thành phần 2) và cụ thể được chọn từ *Bacillus subtilis* chủng NRRL No. B-21661, *Bacillus pumilus* chủng NRRL No. B-30087 và *Ulocladium oudemansii*.

Theo đó, hơn nữa, sáng chế đề cập đến các chế phẩm chứa một hợp chất có công thức I (thành phần 1) và một hoạt chất khác (thành phần 2), mà hoạt chất khác được chọn từ cột “Thành phần 2” của các hàng từ B-1 đến B-369 của bảng B.

Một phương án nữa đề cập đến các chế phẩm từ B-1 đến B-369 được liệt kê trong Bảng B, trong đó một hàng của bảng B trong mỗi trường hợp tương ứng với chế phẩm diệt nấm chứa một trong số các hợp chất được chỉ rõ trong bản mô tả có công thức I (thành phần 1) và hoạt chất khác có liên quan từ các nhóm A) đến O) (thành phần 2) được chỉ rõ trong hàng đang đề cập đến. Tốt hơn là, các chế phẩm được mô tả chứa các hoạt chất với lượng có tác dụng hiệp đồng.

Bảng B: Chế phẩm chứa một hợp chất được chỉ rõ có công thức I và một hoạt chất khác từ các nhóm A) đến O)

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-1	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Azoxystrobin
B-2	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Coumetoxystrobin
B-3	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Coumoxystrobin

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-4	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dimoxystrobin
B-5	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Enestroburin
B-6	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenaminstrobin
B-7	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenoxystrobin/Flufenoxystrobin
B-8	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluoxastrobin
B-9	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Kresoxim-metyl
B-10	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metominostrobin
B-11	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Orysastrobin
B-12	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Picoxystrobin
B-13	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyraclostrobin
B-14	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyrametostrobin
B-15	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyraoxystrobin
B-16	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyribencarb
B-17	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Trifloxystrobin
B-18	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triclopyricarb/Clodincarb
B-19	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Este metyl của axit 2-[2-(2,5-dimetyl-phenoxy-metyl)-phenyl]-3-metoxi-acrylic
B-20	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	2-(2-(3-(2,6-diclophenyl)-1-metyl-alylidenaminooxymetyl)-phenyl)-2-metoxiimino-N-metyl-axetamit
B-21	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benalaxyl
B-22	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benalaxyl-M
B-23	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benodanil
B-24	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benzovindiflupyr
B-25	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bixafen

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-26	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Boscalid
B-27	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carboxin
B-28	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenfuram
B-29	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenhexamid
B-30	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flutolanil
B-31	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluxapyroxad
B-32	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Furametpyr
B-33	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Isopyrazam
B-34	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Isotianil
B-35	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Kiralaxyl
B-36	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mepronil
B-37	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metalaxyl
B-38	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metalaxyl-M
B-39	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ofurace
B-40	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxadixyl
B-41	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxycarboxin
B-42	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Penflufen
B-43	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Penthiopyrad
B-44	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Sedaxan
B-45	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tecloftalam
B-46	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thifluzamit
B-47	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tiadinil
B-48	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Anilit của axit 2-Amino-4-methyl-thiazol-5-carboxylic
B-49	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N-(4'-triflometylthiobi-phenyl-2-yl)-3-diflometyl-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-50	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N-(2-(1,3,3-trimetyl-butyl)-phenyl)-1,3-dimetyl-5-fluor-1H-pyrazol-4-carboxamid
B-51	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-(difluorometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-52	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-(trifluorometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-53	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-54	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-(trifluorometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-55	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-(difluorometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-56	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamid
B-57	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dimethomorph
B-58	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flumorph
B-59	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyrimorph
B-60	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flumetover
B-61	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluopicolite
B-62	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluopyram
B-63	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Zoxamid
B-64	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carpropamid
B-65	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dicloxymet

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-66	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mandipropamid
B-67	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxytetraxyclin
B-68	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Silthiofam
B-69	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Amit của axit N-(6-metoxypyridin-3-yl) xyclopropan-carboxylic
B-70	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Azaconazol
B-71	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bitertanol
B-72	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bromuconazol
B-73	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyproconazol
B-74	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Difenoconazol
B-75	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diniconazol
B-76	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diniconazol-M
B-77	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Epoxiconazol
B-78	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenbuconazol
B-79	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluquinconazol
B-80	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flusilazol
B-81	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flutriafol
B-82	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hexaconazol
B-83	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imibenconazol
B-84	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ipconazol
B-85	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metconazol
B-86	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Myclobutanil
B-87	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxpoconazol
B-88	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Paclobutrazol
B-89	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Penconazol
B-90	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Propiconazol
B-91	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Prothioconazol
B-92	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Simeconazol

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-93	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tebuconazol
B-94	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tetraconazol
B-95	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triadimefon
B-96	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triadimenol
B-97	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triticonazol
B-98	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Uniconazol
B-99	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	1-[<i>rel</i> -(2 <i>S</i> ;3 <i>R</i>)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazol,
B-100	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	2-[<i>rel</i> -(2 <i>S</i> ;3 <i>R</i>)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol
B-101	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyazofamid
B-102	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Amisulbrom
B-103	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazalil
B-104	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazalil-sulfat
B-105	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pefurazoat
B-106	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Prochloraz
B-107	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triflumizol
B-108	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benomyl
B-109	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carbendazim
B-110	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fuberidazol
B-111	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thiabendazol
B-112	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ethaboxam
B-113	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Etridiazol
B-114	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hymexazol

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-115	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	2-(4-Clo-phenyl)-N-[4-(3,4-dimethoxy-phenyl)-isoxazol-5-yl]-2-prop-2-ynyloxy-axetamit
B-116	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluazinam
B-117	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyrifenox
B-118	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-[5-(4-Clo-phenyl)-2,3-dimethyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin (Pyrisoxazol)
B-119	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	3-[5-(4-Metyl-phenyl)-2,3-dimethyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin
B-120	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bupirimat
B-121	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyprodinil
B-122	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	5-Floxytosin
B-123	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	5-Flo-2-(p-tolylmethoxy)pyrimidin-4-amin
B-124	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	5-Flo-2-(4-flophenylmethoxy)pyrimidin-4-amin
B-125	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diflumentorim
B-126	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	(5,8-Difloquinazolin-4-yl)-{2-[2-flo-4-(4-triflometylpyridin-2-yloxy)-phenyl]-etyl}-amin
B-127	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenarimol
B-128	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ferimzon
B-129	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mepanipirim
B-130	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Nitrapyrin

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-131	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Nuarimol
B-132	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyrimethanil
B-133	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triforin
B-134	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenpiclonil
B-135	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fludioxonil
B-136	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Aldimorph
B-137	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dodemorph
B-138	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dodemorph-axetat
B-139	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenpropimorph
B-140	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tridemorph
B-141	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenpropidin
B-142	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Floimid
B-143	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iprodion
B-144	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Proxymidon
B-145	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Vinclozolin
B-146	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Famoxadon
B-147	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenamidon
B-148	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flutianil
B-149	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Octhilinon
B-150	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Probenazol
B-151	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenpyrazamin
B-152	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Axibenzolar-S-metyl
B-153	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ametoctradin
B-154	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Amisulbrom

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-155	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	[(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3- [(3-isobutyryloxymethoxy-4- methoxypyridin- 2-carbonyl)amino]-6-methyl- 4,9-dioxo-[1,5]dioxonan-7- yl] 2-methylpropanoat
B-156	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	[(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3- [(3-axetoxo-4-methoxy- pyridin-2-carbonyl)amino]- 6-methyl-4,9-dioxo-1,5- dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat
B-157	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	[(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3- [[3-(axetoxymethoxy)-4- methoxy-pyridin- 2-carbonyl]amino]-6-methyl- 4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat
B-158	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	[(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3- [(3-isobutoxycarbonyloxy-4- methoxy-pyridin- 2-carbonyl)amino]-6-methyl- 4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-159	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	[(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ylmethoxy)-4-methoxy-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat
B-160	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	(3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hydroxy-4-methoxy-2-pyridinyl)carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-8-(phenylmethyl)-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat
B-161	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Anilazin
B-162	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Blastixidin-S
B-163	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Captafol
B-164	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Captan
B-165	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Chinomethionat
B-166	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dazomet
B-167	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Debacarb
B-168	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diclomezin
B-169	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Difenzoquat,
B-170	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Difenzoquat-metylsulfat
B-171	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenoxanil
B-172	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Folpet
B-173	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxolinsäure
B-174	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Piperalin
B-175	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Proquinazid
B-176	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyroquilon
B-177	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Quinoxifen

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-178	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triazoxid
B-179	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Trioxyclozol
B-180	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	2-Butoxy-6-iodo-3-propyl-chromen-4-on
B-181	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	5-Clo-1-(4,6-dimetoxy-pyrimidin-2-yl)-2-metyl-1H-benzoimidazol
B-182	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	5-Clo-7-(4-metyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflo-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin
B-183	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ferbam
B-184	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mancozeb
B-185	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Maneb
B-186	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metam
B-187	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Methasulphocarb
B-188	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metiram
B-189	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Propineb
B-190	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thiram
B-191	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Zineb
B-192	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Ziram
B-193	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diethofencarb
B-194	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Benthiavalicarb
B-195	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iprovalicarb
B-196	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Propamocarb
B-197	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Propamocarb hydrochlorid
B-198	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Valifenalat

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-199	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Este (4-flophenyl) của axit N-(1-(1-(4-xyanophenyl)etansulfonyl)-but-2-yl) carbamic
B-200	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dodin
B-201	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bazơ không chứa dodin
B-202	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Guazatin
B-203	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Guazatin-axetat
B-204	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iminoctadin
B-205	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iminoctadin-triaxetat
B-206	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iminoctadin-tris(albesilat)
B-207	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Kasugamycin
B-208	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Kasugamycin-hydroclorua-hydrat
B-209	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Polyoxin
B-210	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Streptomycin
B-211	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Validamycin A
B-212	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Binapacryl
B-213	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dicloran
B-214	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dinobuton
B-215	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dinocap
B-216	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Nitrothal-isopropyl
B-217	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tecnazen
B-218	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Muối fentin
B-219	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dithianon
B-220	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino [2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraon

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-221	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Isoprothiolan
B-222	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Edifenphos
B-223	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fosetyl, Fosetyl-nhôm
B-224	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iprobenfos
B-225	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Axit phosphor (H_3PO_3) và các dẫn xuất
B-226	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyrazophos
B-227	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tolclofos-metyl
B-228	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clothalonil
B-229	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diclofluanid
B-230	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diclophen
B-231	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flusulfamit
B-232	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hexaclobenzen
B-233	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Penxycuron
B-234	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pentaclophenol và muối
B-235	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Phtalit
B-236	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Quintozen
B-237	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thiophanat Metyl
B-238	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tolylfluanid
B-239	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N-(4-clo-2-nitro-phenyl)-N-etyl-4-metyl-benzensulfonamit
B-240	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hỗn hợp bordeaux
B-241	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Đồng axetat
B-242	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Đồng hydroxit
B-243	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Đồng oxyclorea
B-244	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Đồng bazơ sulfat
B-245	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Lưu huỳnh
B-246	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Biphenyl

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-247	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bronopol
B-248	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyflufenamid
B-249	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xymoxanil
B-250	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diphenylamin
B-251	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metrafenon
B-252	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyriofenon
B-253	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mildiomyxin
B-254	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxin-đồng
B-255	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Oxathiapiprolin
B-256	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Prohexadion canxi
B-257	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Spiroxamin
B-258	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tebufloquin
B-259	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tolylfluanid
B-260	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N- (Xyclopropylmetoxyimino- (6-diflometoxy-2,3-diflo- phenyl)-metyl)-2-phenyl ax- etamit
B-261	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N'-(4-(4-clo-3-triflometyl- phenoxy)-2,5-dimetyl- phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin
B-262	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N'-(4-(4-flo-3-triflometyl- phenoxy)-2,5-dimetyl- phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin
B-263	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N'-(2-metyl-5-triflometyl-4- (3-trimetylsilanyl-propoxy)- phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-264	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	N'-(5-diflometyl-2-metyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin
B-265	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Este 6-tert-butyl-8-flo-2,3-dimetyl-quinolin-4-yl của axit metoxy-axetic
B-266	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	<i>Bacillus subtilis</i> NRRL No. B-21661
B-267	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	<i>Bacillus pumilus</i> NRRL No. B-30087
B-268	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	<i>Ulocladium oudemansii</i>
B-269	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carbaryl
B-270	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carbofuran
B-271	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Carbosulfan
B-272	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metomylthiodicarb
B-273	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bifenthrin
B-274	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyfluthrin
B-275	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xypermethrin
B-276	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	alpha-Xypermethrin
B-277	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	zeta-Xypermethrin
B-278	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Deltamethrin
B-279	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Esfenvalerat
B-280	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Lambda-xyhalothrin
B-281	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Permethrin
B-282	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tefluthrin
B-283	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diflubenzuron
B-284	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flufenoxuron
B-285	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Lufenuron

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-286	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Teflubenzuron
B-287	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Spirotetramat
B-288	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clothianidin
B-289	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dinotefuran
B-290	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imidacloprid
B-291	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thiamethoxam
B-292	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flupyradifuron
B-293	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Axetamiprid
B-294	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Thiacloprid
B-295	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Endosulfan
B-296	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fipronil
B-297	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Abamectin
B-298	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Emamectin
B-299	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Spinosad
B-300	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Spinetoram
B-301	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hydrametylnon
B-302	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clofenapyr
B-303	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenbutatin oxit
B-304	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Indoxacarb
B-305	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metaflumizon
B-306	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Flonicamid
B-307	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Lubendiamit
B-308	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Cloantraniliprol
B-309	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyazypyr (HGW86)
B-310	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyflumetofen
B-311	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Axetoclo
B-312	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dimethenamid
B-313	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metolaclo
B-314	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metazaclo

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-315	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Glyphosat
B-316	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Glufosinat
B-317	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Sulfosat
B-318	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clodinafop
B-319	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fenoxaprop
B-320	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluazifop
B-321	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Haloxifyop
B-322	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Paraquat
B-323	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Phenmedipham
B-324	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clethodim
B-325	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xycloxydim
B-326	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Profoxydim
B-327	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Setoxydim
B-328	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Tepraloxymid
B-329	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pendimethalin
B-330	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Prodiamin
B-331	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Trifluralin
B-332	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Axifluorfen
B-333	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bromoxynil
B-334	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazamethabenz
B-335	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazamox
B-336	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazapic
B-337	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazapyr
B-338	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazaquin
B-339	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Imazethapyr
B-340	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	(2,4-D) của axit 2,4-Diclophenoxyacetic
B-341	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Cloidazon
B-342	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Clopyralid

Hỗn hợp	Thành phần 1	Thành phần 2
B-343	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Fluroxypyr
B-344	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Picloram
B-345	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Picolinafen
B-346	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bensulfuron
B-347	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Cloimuron-etyl
B-348	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xyclosulfamuron
B-349	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Iodosulfuron
B-350	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mesosulfuron
B-351	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Metsulfuron-metyl
B-352	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Nicosulfuron
B-353	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Rimsulfuron
B-354	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Triflusulfuron
B-355	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Atrazin
B-356	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Hexazinon
B-357	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diuron
B-358	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Florasulam
B-359	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Pyroxasulfon
B-360	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Bentazon
B-361	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xinidon-etyl
B-362	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Xinmetylin
B-363	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Dicamba
B-364	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Diflufenzopyr
B-365	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Quinclorac
B-366	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Quinmerac
B-367	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Mesotrion
B-368	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Saflufenaxil
B-369	một hợp chất được chỉ rõ có công thức I	Topramezon

Các hoạt chất được đề cập đến như là thành phần 2, cách điều chế chúng và hoạt tính của chúng chống lại nấm có hại là đã được biết đến (cf.:

<http://www.alanwood.net/pesticides/>); các chất này được bán sẵn trên thị trường. Các hợp chất được mô tả bởi danh mục IUPAC, cách điều chế chúng và hoạt tính diệt nấm của chúng là cũng đã được biết đến (cf. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP-A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP-A 243 970; EP-A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP-A 1 201 648; EP-A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657).

Hỗn hợp của các hoạt chất có thể được điều chế như các chế phẩm chứa ít nhất một thành phần trợ bên cạnh các thành phần hoạt tính bằng các phương tiện thông thường, ví dụ, bằng phương tiện được đưa ra đối với các chế phẩm của các hợp chất có công thức I.

Liên quan đến các thành phần thông thường của các chế phẩm này, có thể tham khảo phần giải thích được nêu ra đối với các chế phẩm chứa các hợp chất có công thức I.

Hỗn hợp của các hoạt chất theo sáng chế là thích hợp làm các thuốc diệt nấm, như là các hợp chất có công thức I. Chúng được phân biệt bởi hiệu quả nổi trội chống lại phổ rộng các loại nấm gây bệnh ở cây, đặc biệt là từ các lớp nấm nang, nấm đảm, Deuteromycetes và Peronosporomycetes (nhóm nấm noãn tổng hợp). Ngoài ra, có thể tham khảo phần giải thích liên quan đến hoạt tính diệt nấm của các hợp chất và các chế phẩm chứa các hợp chất có công thức I, theo thứ tự lần lượt.

Ví dụ thực hiện sáng chế

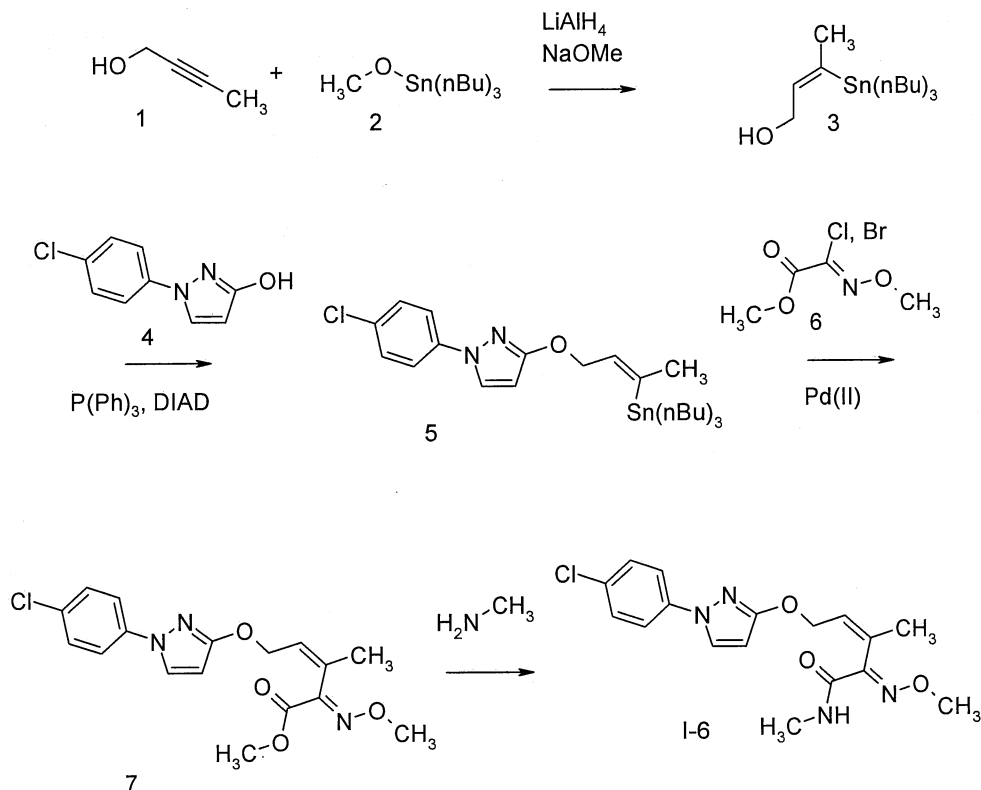
I. Các ví dụ tổng hợp

Với sự cải biến thích đáng đối với các hợp chất khơi mào, các quy trình được thể hiện trong các ví dụ tổng hợp dưới đây được sử dụng để thu được thêm các hợp chất có

công thức I. Các hợp chất thu được, cùng với dữ liệu vật lý, được liệt kê trong Bảng I dưới đây.

I.1 Điều chế các hợp chất loại strobilurin có công thức I

Ví dụ 1: Điều chế metyl amit của axit (Z)-5-[1-(4-Clo-phenyl)-1H-pyrazol-3-yloxy]-2-[(E)-metoxyimino]-3-metyl-pent-3-enic (I-6)



Ví dụ 1a: (Z)-3-Tributylstananyl-but-2-en-1-ol (3)

0,77g (14,3 mmol) natri metylat được bổ sung vào 156,9ml (156,9mmol) của 1mol dung dịch lithi-nhôm-hydrua trong THF và nhiệt độ được hạ xuống 0°C sau đấy. sau đó, dung dịch của 10,0g (142,7mmol) 2-butin-1-ol trong 108ml THF được bổ sung vào từng giọt cùng với khuấy ở nhiệt độ này. Tiếp tục khuấy trong 36 giờ ở nhiệt độ 4°C . Sau đó, ở nhiệt độ 0°C , 28,6ml (292,5mmol) etyl axetat được bổ sung vào từ từ trong khi đang khuấy. Phản ứng tỏa nhiệt mạnh được quan sát thấy. Tiếp tục khuấy trong 10 phút mà không cần làm mát. Sau khi làm mát xuống 0°C , 45,8g (142,7mmol) tri(n-butyl)stannyl-metanolat được bổ sung vào từng giọt trong khi đang khuấy. Tiếp tục khuấy trong 2 ngày ở nhiệt độ 4°C . Sau khi bổ sung vào 112,9g methanol, tiếp tục khuấy trong 1 giờ ở nhiệt độ xung quanh. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào 250ml nước, được chiết ba lần, mỗi lần với 150ml ete dietyl, phần chiết tổng hợp lại được rửa hai lần, mỗi lần với 80ml nước,

sau đó mỗi lần với 40ml dung dịch natri clorua dạng nước bão hòa, được sấy khô với natri sulfat và được cô đặc trong chân không. Thu được 48,6g dầu, mà được tinh chất bởi phép sắc ký trên 300g silica gel với hexan/MTBE (10:1). Cuối cùng thu được 34,6g (67%) dầu. δ = 0,90 (m); 1,30 (m); 1,50 (m); 1,97 (s); 4,02 (t); 6,27 (t).

Ví dụ 1b : 1-(4-Clo-phenyl)-3-((Z)-3-tributylstananyl-but-2-enyloxy)-1H-pyrazol (5)

6,23g (30,8mmol) este diisopropyl của axit azodicarbonic được bổ sung vào 8,09g (30,8mmol) triphenylphosphin trong 200ml THF cùng với khuấy ở nhiệt độ -75°C . Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ này trong 5 phút. Sau đó, 10,39g (28,8mmol) (Z)-3-tributylstananyl-but-2-en-1-ol được bổ sung vào từng giọt và được khuấy trong 5 phút ở nhiệt độ -75°C . Sau khi bổ sung vào 4,00g (20,6mmol) 1-(4-clophenyl)-3-hydroxypyrazol ở nhiệt độ -75°C tạo thành thể huyền phù màu đỏ. Hỗn hợp được cho làm ấm lên đến nhiệt độ xung quanh và được khuấy trong 3 ngày. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, 29g dầu thu được và được tinh chế bằng phép sắc ký trên 120g silic oxit với MTBE/heptan. Thu được 8,3g (75%) dầu. δ = 0,85 (m); 0,95 (m); 1,30 (m); 1,50 (m); 2,00 (s); 4,65 (d); 5,90 (d); 6,43 (t); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,68 (d).

Ví dụ 1c: Este metyl của axit (Z)-5-[1-(4-Clo-phenyl)-1H-pyrazol-3-yloxy]-2-[(E)-metoxyimino]-3-metyl-pent-3-enic (7)

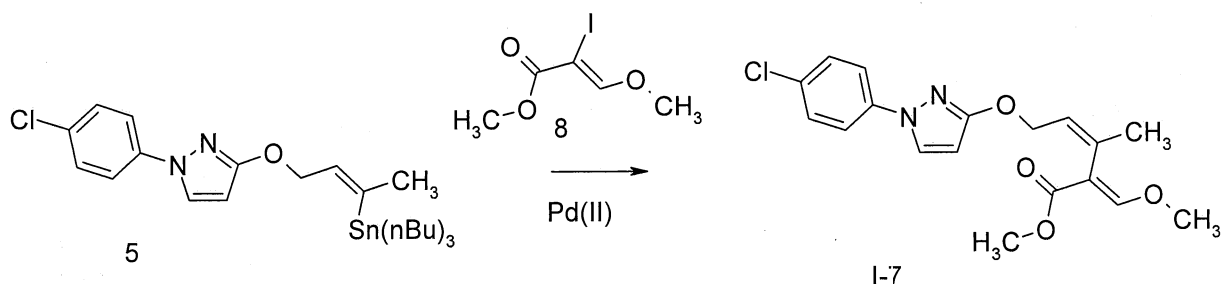
3,00g (5,58mmol) 1-(4-Clo-phenyl)-3-((Z)-3-tributylstananyl-but-2-enyloxy)-1H-pyrazol, 1,15g (5,86mmol) bromua của axit hydroxamic (6), 0,155g (0,67mmol) tri(2-furyl)phosphin và 96mg (0,17mmol) bis(dibenzylidenaxeton)-paladi được khuấy trong 10ml 1,4-dioxan trong 4 ngày ở nhiệt độ 80°C . Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, 4,3g dầu thu được và được tinh chế bằng phép sắc ký trên 70g silic oxit với MTBE/heptan/1% triethylamin. Thu được 1,2g (59%) dầu. δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (d); 5,85 (d); 5,93 (t); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,65 (d).

Ví dụ 1d: Amit metyl của axit (Z)-5-[1-(4-Clo-phenyl)-1H-pyrazol-3-yloxy]-2-[(E)-metoxyimino]-3-metyl-pent-3-enic (I-6)

120mg (0,33mmol) este metyl của axit (Z)-5-[1-(4-clo-phenyl)-1H-pyrazol-3-yloxy]-2-[(E)-metoxyimino]-3-metyl-pent-3-enic và 0,99ml (1,98mmol) của 2mol dung dịch metyl amin trong THF được khuấy qua đêm ở nhiệt độ xung quanh trong 2,0ml THF và 0,5ml nước. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, sản phẩm (120mg) thu

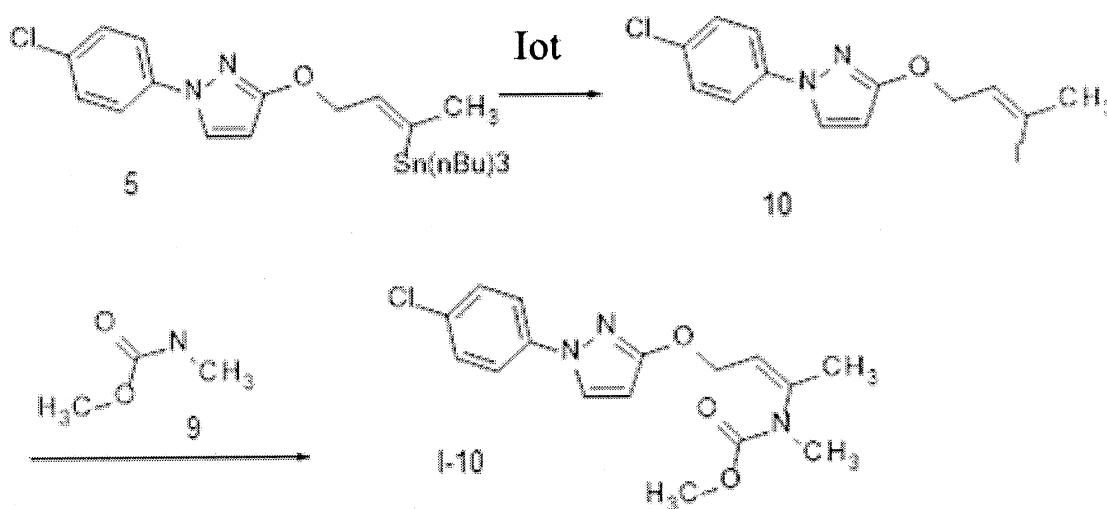
được với năng suất định lượng và độ tinh khiết tốt. Điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 129 đến 130°C.

Ví dụ 2: Este metyl của axit (Z)-5-[1-(4-Clo-phenyl)-1H-pyrazol-3-yloxy]-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-3-metyl-pent-3-enoic (hợp chất có công thức I-7)



1,50g (2,79mmol) 1-(4-Clo-phenyl)-3-((Z)-3-tributylstananyl-but-2-enyloxy)-1H-pyrazol (5), 0,81g (3,35mmol) hợp chất este (8) [Chem Comm 4, 423-425, (2006)], 0,223g (0,28mmol) [(R)-(+)-2,2''-Bis(diphenylphosphino)-1,1''-bisanptyl]-paladi(II)clorua được khuấy trong 14ml 1,4-dioxan trong 4,5 ngày ở nhiệt độ 100°C. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, sản phẩm thô thu được, mà được tinh chế bằng phép sắc ký trên 50g silic oxit với MTBE/hexan/2% triethylamin. Thu được 0,12g, điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 123 đến 125°C.

Ví dụ 3: Metyl N-[(Z)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-1-metyl-prop-1-enyl]-N-metyl-carbamat (I-10)



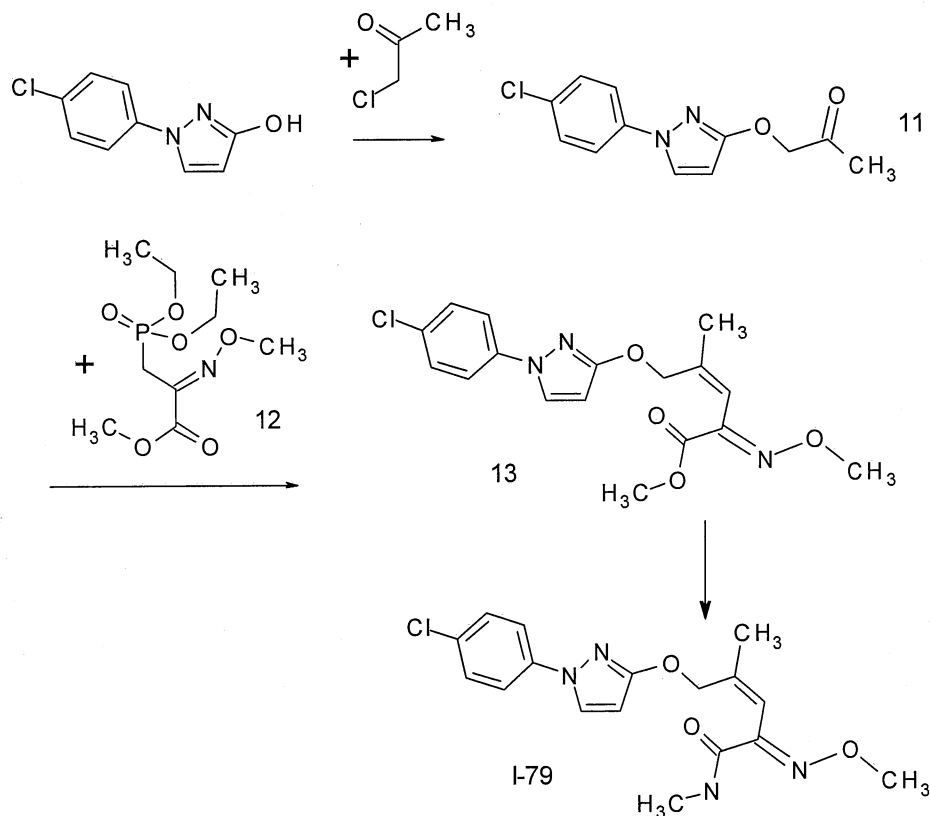
Ví dụ 3a: 1-(4-clophenyl)-3-[(Z)-3-iodobut-2-enoxyl]pyrazol (10)

4,7g (18,6mmol) iod được bổ sung vào 10,0g (18,6mmol) 1-(4-clo-phenyl)-3-((Z)-3-tributylstananyl-but-2-enyloxy)-1H-pyrazol trong 100ml metylen clorua ở nhiệt độ xung quanh cùng với khuấy trong 3 giờ. Sau khi lấy dung môi ra trong chân không, sản phẩm thô được hòa tan trong 200ml MTBE. 100ml dung dịch kali florua 20% dạng nước được bổ sung vào và hỗn hợp được khuấy trong 2 giờ ở nhiệt độ xung quanh. Lớp dạng nước được tách và được chiết hai lần với 20ml ete metyl-tert.-butyl. Các pha hữu cơ tổng hợp lại được rửa hai lần, mỗi lần với 20ml nước, được sấy khô với natri sulfat, và các dung môi được lấy ra trong chân không. Sản phẩm thô (7,2g) được tinh chế bằng phép sắc ký trên 50g silic oxit với ete metyl-tert.-butyl/hexan (1:20). Thu được 5,9g, điểm nóng chảy nằm trong khoảng từ 75 đến 77°C.

Ví dụ 3b: Metyl N-[(Z)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-1-metyl-prop-1-enyl]-N-metyl-carbamat

1,50g (4,00mmol) 1-(4-clophenyl)-3-[(Z)-3-iodobut-2-enoxyl]pyrazol, 0,43g (4,81mmol) este metyl của axit N-metylcarbamic (9), 76mg (0,4mmol) đồng iodua, 1,27g (6,00mmol) kali phosphat và 71mg (0,80mmol) N,N'-dimetyletylen diamin trong 14ml toluene được khuấy trong 1,5 ngày ở nhiệt độ 100°C. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, sản phẩm thô được tinh chế bằng phép sắc ký trên 50g silic oxit với MTBE/hexan (1:3). Thu được 0,67g. ¹H-NMR (CDCl₃): δ = 1,90 (s); 3,05 (s); 3,70 (s); 4,68 (m); 5,63 (m); 5,90 (d); 7,35 (m); 7,55 (m); 7,68 (d).

Ví dụ 4: (Z,2E)-5-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxylimino-N,4-dimetyl-pent-3-enamit (hợp chế I-79)



Ví dụ 4a: 1-[1-(4-Clophenyl)pyrazol-3-yl]oxypropan-2-on (11)

5,50g (28,3mmol) 1-(4-clophenyl)pyrazol-3-ol, 3,91g (28,3mmol) kali carbonat và 50mg natri iodua trong 30ml DMF được khuấy trong 5 phút ở nhiệt độ xung quanh. Sau đó, 2,62g (28,3mmol) cloaxeton được bổ sung vào từng giọt trong khi tiếp tục khuấy ở nhiệt độ 60°C trong 5 giờ. Hỗn hợp được đổ vào dung dịch lithi clorua dạng nước hơn 10% và được chiết ba lần với etyl axetat. Phần chiết tổng hợp lại được rửa hai lần với dung dịch lithi clorua 10% và được sấy khô với natri sulfat. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, sản phẩm thô được tinh chế bằng phép sắc ký trên silic oxit. Thu được 6,5g. Sản phẩm được sử dụng cho bước tiếp theo.

Ví dụ 4b: Metyl (Z,2E)-5-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxylimino-4-metyl-pent-3-enoat và chất đồng phân E (13)

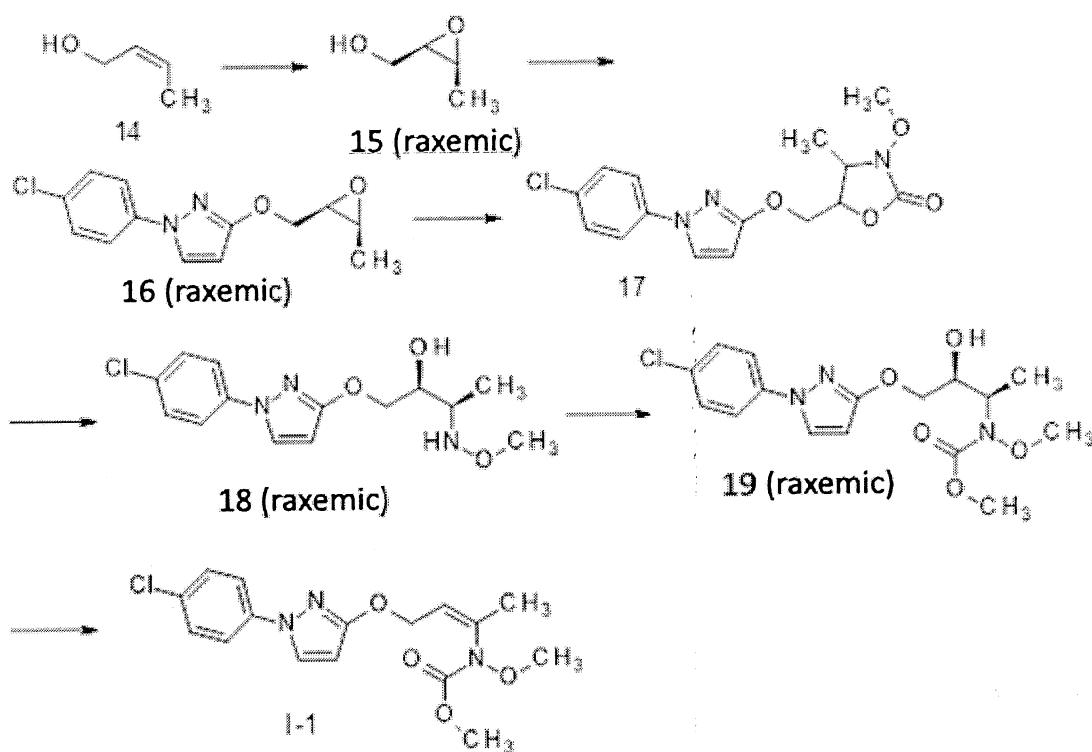
2,59g (23,1mmol) kali tert.-butylat được bổ sung vào 5,26g (21,0mmol) 1-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxypropan-2-on và 7,20g (26,9mmol) metyl (2Z)-3-dietoxyphosphoryl-2-metoxylimino-propanoat (mà có thể được điều chế như mô tả đối

với dẫn xuất dimetoxo [(Tetrahedron Let 29, 3361-3364 (1988)] trong 100ml THF ở nhiệt độ xung quanh cùng với khuấy. Tiếp tục khuấy qua đêm. Sau khi lấy dung môi ra trong chân không, hỗn hợp được tinh chế bằng phép sắc ký trên silic oxit với heptan/etyl axetat. Thu được 1,07g hỗn hợp E:Z tỷ lệ 80:20. Hỗn hợp này được sử dụng trực tiếp cho bước tiếp theo.

Ví dụ 4c: Z,2E)-5-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxylimino-N,4-dimetyl-pent-3-enamit

0,68g (1,87mmol) metyl (Z,2E)-5-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxylimino-4-metyl-pent-3-enoat và chất đồng phân E từ phản ứng trước được hòa tan trong 3,0ml THF. 2,0ml metylamin dạng nước 40% được bổ sung vào ở nhiệt độ xung quanh cùng với tiếp tục khuấy qua đêm. Sau khi lấy dung dịch ra trong chân không, hỗn hợp được tinh chế bằng phép sắc ký trên silic oxit với gradien heptan/etyl axetat. Thu được 90mg chất đồng phân Z mong muốn. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 2,03$ (s); 2,85 (d); 3,97 (s); 4,64 (s); 5,87 (s); 6,02 (d); 6,65 (br); 7,35 (d); 7,50 (d); 7,67 (d).

Ví dụ 5: Metyl N-[(Z)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-1-metyl-prop-1-enyl]-N-metoxycarbamat (I-1)



Ví dụ 5a: Cis-3-metyloxiran-2-yl]metanol (15)

37,6g (152,6mmol) axit 3-cloperbenzoic (độ tinh khiết 70%) được bổ sung từng phần nhỏ vào 10,0g (138,7mmol) Z-but-2-en-1-ol trong 140ml diclometan (DCM) ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 đến 5°C cùng với khuấy. Tiếp tục khuấy ở nhiệt độ 0°C trong 2 giờ. 35,0g canxi hydroxit được bổ sung vào ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 đến 5°C cùng với tiếp tục khuấy trong 2 giờ ở nhiệt độ 0°C. Chất kết tủa được lọc, được rửa với DCM, và chất lọc được sấy khô với natri sulfat. Dung môi được loại bỏ phần lớn ở 380mbar/30°C. Sản phẩm thô (15,0 g, độ tinh khiết 75%) được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

Ví dụ 5b: 1-(4-clophenyl)-3-[[[(2R,3S)-3-metyloxiran-2-yl]metoxy]pyrazol triệt quang (16)

22,9g (113,0mmol) este diisopropyl của axit azodicarbonic được bổ sung vào 28,3g (107,9mmol) triphenylphosphin và 15,0g (127,7mmol) cis-3-metyloxiran-2-yl]metanol (15) từ thí nghiệm trước trong 400ml THF cùng với khuấy ở nhiệt độ -75°C. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ này trong 5 phút. Sau đó, 20,0g (102,8mmol) 1-(4-clophenyl)-3-hydroxypyrazol được bổ sung vào cùng với khuấy ở nhiệt độ -70°C. Hỗn hợp được làm cho ấm lên đến nhiệt độ xung quanh và được khuấy trong 1 ngày. Sau khi lấy dung môi ra trong chân không, sản phẩm thô được khuấy với 200ml diisopropylete thu được 42g chất rắn và được tinh chế thêm bằng phép sắc ký trên 330g silic oxit với MTBE/heptan. Thu được 22,5g (82%).

Ví dụ 5c: 5-[[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxymetyl]-3-metoxi-4-metyl-oxazolidin-2-on (17)

1,00g (8,9mmol) kali tert.-butylat được bổ sung vào 1,08g (10,0mmol) metyl N-metoxycarbamat trong 17ml DMSO cùng với khuấy ở nhiệt độ xung quanh. Tiếp tục khuấy trong 5 phút trước khi 2,00g (7,56mmol) 1-(4-clophenyl)-3-[[[(2R,3S)-3-metyloxiran-2-yl]metoxy]pyrazol được bổ sung vào. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 90°C trong 20 giờ. Sau khi làm mát đến nhiệt độ xung quanh, hỗn hợp phản ứng được đổ vào 150ml nước, được chiết ba lần, mỗi lần với 30ml etyl axetat, phần chiết được tổng hợp lại được sấy khô với natri sulfat và dung môi được lấy ra trong chân không. Sản phẩm thô (2,5g) được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

Ví dụ 5d: (2S,3R-1-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-3-(metoxyamino)butan-2-ol triệt quang (18)

14,6g (40,0mmol) dung dịch natri etylat 21% (trong etanol) được bổ sung vào 10,0g (30,0mmol) 5-[[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxymetyl]-3-metoxo-4-metyl-oxazolidin-2-on trong 100ml etanol ở nhiệt độ xung quanh cùng với khuấy và khuấy qua đêm. Dung môi được loại bỏ phần lớn trong chân không và hỗn hợp còn lại được đổ vào 250ml dung dịch natri dihydrophosphat dạng nước, được chiết ba lần, mỗi lần với 150ml etyl axetat, được sấy khô với natri sulfat để thu được 8,7g dầu sau khi làm bay hơi dung môi trong chân không. Tinh chế thêm bằng phép sắc ký trên 120g silic oxit với MTBE/heptan. Thu được 4,0g (43%). $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ = 1,22 (d); 3,17 (m); 3,57 (s); 3,91 (m); 4,33 (m); 4,47 (m); 5,93 (s); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,68 (s).

Ví dụ 5e: Metyl N-[(1R,2S)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-hydroxy-1-metyl-propyl]-N-metoxo-carbamat triệt quang (19)

0,28g (3,5mmol) natri hydrocarbonat được bổ sung vào 1,00g (3,2mmol) (2S,3R-1-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-3-(metoxyamino)butan-2-ol triệt quang trong 7ml THF. Sau đó, 0,33g (3,5mmol) metyl cloformiat được bổ sung vào từng giọt cùng với khuấy ở nhiệt độ xung quanh. Tiếp tục khuấy qua đêm. Hỗn hợp phản ứng được đổ vào 10ml nước, được chiết ba lần, mỗi lần với 10ml MTBE, phần chiết tổng hợp lại được sấy khô với natri sulfat, và dung môi được lấy ra trong chân không. Sản phẩm thô (1,3g) được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

Ví dụ 5f: Metyl N-[(Z)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-1-metyl-prop-1-enyl]-N-metoxo-carbamat (I-1)

2,61g (9,94mmol) triphenylphoshin được bổ sung vào 3,50g (9,46mmol) metyl N-[(1R,2S)-3-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-hydroxy-1-metyl-propyl]-N-metoxo-carbamat triệt quang trong 13ml THF cùng với khuấy ở nhiệt độ xung quanh. Hỗn hợp được làm mát tới nhiệt độ -15°C . Sau đó, 2,11g (10,41mmol) este diisopropyl của axit azodicarbonic được bổ sung cùng với tiếp tục khuấy trong 1 giờ ở nhiệt độ 0°C và 1 giờ ở nhiệt độ xung quanh. Sau khi lấy dung môi ra trong chân không, sản phẩm thô được tinh chế thêm bằng phép sắc ký trên 25g silic oxit với MTBE/heptan/1% trietylamin. $^1\text{H-NMR}$

NMR (CDCl₃): δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d).

Bảng I. Hợp chất có công thức I với dữ liệu vật lý (điểm nóng chảy [°C]; ¹H-NMR (CDCl₃) (δ); thời gian lưu giữ HPLC/MS [phút])

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-1	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d)
I-2	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	NH	Y-1	
I-3	CH ₃	H	R3-1	R4-3	O	Y-1	
I-4	CH ₃	H	R3-1	R4-3	NH	Y-1	
I-5	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	88-89°C
I-6	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	130°C
I-7	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-1	123-125°C
I-8	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-1	
I-9	CH ₃	H	R3-1	R4-7		Y-1	
I-10	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = CH ₃	O	Y-1	δ = 1,90 (s); 3,05 (s); 3,70 (s); 4,68 (m); 5,63 (m); 5,90 (d); 7,35 (m); 7,55 (m); 7,68 (d)
I-11	CH ₃	H	R3-2	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,87 (m); 5,95 (m); 6,70 (br); 6,95 (m); 7,73 (m); 7,80 (m)
I-12	CH ₃	H	R3-3	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,52 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 6,75 (br); 6,95 (m); 7,30 (m)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-13	CH ₃	H	R3-4	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,38 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,88 (d); 5,95 (m); 6,75 (br); 7,13 (m); 7,28 (m); 7,41 (d); 7,64 (d)
I-14	CH ₃	H	R3-5	R4-1	NH	Y-1	125-127°C
I-15	CH ₃	H	R3-6	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 6,70 (br); 7,32 (m); 7,50 (s); 7,54 (d); 7,70 (d)
I-16	CH ₃	H	R3-7	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,88 (d); 5,94 (m); 6,70 (br); 7,45 (m); 7,64 (s); 7,72 (d)
I-17	CH ₃	H	R3-8	R4-1	NH	Y-1	
I-18	CH ₃	H	R3-9	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,33 (s); 2,88 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,85 (m); 5,95 (m); 6,70 (br); 7,03 (t); 7,30 (m); 7,44 (m); 7,62 (m)
I-19	CH ₃	H	R3-10	R4-1	NH	Y-1	
I-20	CH ₃	H	R3-11	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,30 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 6,73 (br); 7,15 (d); 7,27 (m); 7,35 (d); 7,63 (d)
I-21	CH ₃	H	R3-12	R4-1	NH	Y-1	
I-22	CH ₃	H	R3-13	R4-1	NH	Y-1	
I-23	CH ₃	H	R3-14	R4-1	NH	Y-1	
I-24	CH ₃	H	R3-15	R4-1	NH	Y-1	
I-25	CH ₃	H	R3-16	R4-1	NH	Y-1	
I-26	CH ₃	H	R3-17	R4-1	NH	Y-1	
I-27	CH ₃	H	R3-14	R4-1	NH	Y-1	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-28	CH ₃	H	R3-18	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,57 (m); 5,87 (m); 5,95 (m); 6,70 (br); 7,07 (m); 7,33 (m); 7,55 (m); 7,64 (m)
I-29	CH ₃	H	R3-19	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,88 (d); 5,94 (m); 6,70 (br); 7,15 (m); 7,30 (m); 7,43 (m); 7,64 (s); 7,70 (d)
I-30	CH ₃	H	R3-20	R4-1	NH	Y-1	
I-31	CH ₃	H	R3-21	R4-1	NH	Y-1	
I-32	CH ₃	H	R3-22	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,37 (s); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,86 (d); 5,93 (m); 6,70 (br); 7,20 (m); 7,45 (m); 7,65 (d)
I-33	CH ₃	H	R3-23	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,23 (m); 1,95 (s); 2,64 (m); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,58 (m); 5,87 (d); 5,95 (m); 6,70 (br); 7,25 (m); 7,48 (m); 7,67 (d)
I-34	CH ₃	H	R3-24	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 6,70 (br); 7,67 (m); 7,75 (d)
I-35	CH ₃	H	R3-25	R4-1	NH	Y-1	
I-36	CH ₃	H	R3-26	R4-1	NH	Y-1	
I-37	CH ₃	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	
I-38	CH ₃	H	R3-28	R4-1	NH	Y-1	
I-39	CH ₃	H	R3-29	R4-1	NH	Y-1	
I-40	CH ₃	H	R3-30	R4-1	NH	Y-1	
I-41	CH ₃	H	R3-31	R4-1	NH	Y-1	
I-42	CH ₃	H	R3-32	R4-1	NH	Y-1	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-43	CH ₃	H	R3-33	R4-1	NH	Y-1	
I-44	CH ₃	H	R3-34	R4-1	NH	Y-1	
I-45	CH ₃	H	R3-35	R4-1	NH	Y-1	
I-46	CH ₃	H	R3-36	R4-1	NH	Y-1	
I-47	CH ₃	H	R3-37	R4-1	NH	Y-1	
I-48	CH ₃	H	R3-38	R4-1	NH	Y-1	
I-49	CH ₃	H	R3-39	R4-1	NH	Y-1	
I-50	CH ₃	H	R3-40	R4-1	NH	Y-1	
I-51	CH ₃	H	R3-41	R4-1	NH	Y-1	
I-52	CH ₃	H	R3-42	R4-1	NH	Y-1	
I-53	CH ₃	H	R3-43	R4-1	NH	Y-1	
I-54	CH ₃	H	R3-44	R4-1	NH	Y-1	
I-55	CH ₃	H	R3-45	R4-1	NH	Y-1	
I-56	CH ₃	H	R3-46	R4-1	NH	Y-1	
I-57	CH ₃	H	R3-47	R4-1	NH	Y-1	
I-58	CH ₃	H	R3-45	R4-1	NH	Y-1	
I-59	CH ₃	H	R3-49	R4-1	NH	Y-1	
I-60	CH ₃	H	R3-50	R4-1	NH	Y-1	
I-61	CH ₃	H	R3-51	R4-1	NH	Y-1	
I-62	CH ₃	H	R3-52	R4-1	NH	Y-1	
I-63	CH ₃	H	R3-53	R4-1	NH	Y-1	
I-64	CH ₃	H	R3-54	R4-1	NH	Y-1	
I-65	CH ₃	H	R3-55	R4-1	NH	Y-1	
I-66	CH ₃	H	R3-56	R4-1	NH	Y-1	
I-67	CH ₃	H	R3-57	R4-1	NH	Y-1	
I-68	CH ₃	H	R3-58	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-69	CH ₃	H	R3-58	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	NH	Y-1	
I-70	CH ₃	H	R3-58	R4-3	O	Y-1	
I-71	CH ₃	H	R3-58	R4-3	NH	Y-1	
I-72	CH ₃	H	R3-27	R4-1	O	Y-1	
I-73	CH ₃	H	R3-58	R4-2	O	Y-1	
I-74	CH ₃	H	R3-58	R4-2	NH	Y-1	
I-75	CH ₃	H	R3-58	R4-7		Y-1	
I-76	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	
I-77	C ₂ H ₅	H	R3-2	R4-1	NH	Y-1	
I-78	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	
I-79	H	CH ₃	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,03 (s); 2,85 (d); 3,97 (s); 4,64 (s); 5,87 (s); 6,02 (d); 6,65 (br); 7,35 (d); 7,50 (d); 7,67 (d)
I-80	H	CH ₃	R3-1	R4-1	O	Y-1	
I-81	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-3	
I-82	CH ₃	H	R3-59	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,16 (s); 2,18 (s); 2,30 (s); 2,90 (s); 3,97 (s); 4,33 (m); 4,65 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,55 (s); 6,65 (br); 6,96 (s)
I-83	CH ₃	H	R3-60	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,22 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,67 (m); 5,30 (m); 5,88 (m); 6,07 (m); 6,65 (br); 6,73 (d); 7,35 (d); 7,43 (s)
I-84	CH ₃	H	R3-61	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,18 (s); 2,28 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,67 (s); 5,39 (d); 5,43 (d); 5,88 (m); 6,57 (s); 6,65 (br); 6,95 (s)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-85	CH ₃	H	R3-62	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,21 (s); 2,25 (s); 2,89 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,70 (s); 5,39 (d); 5,44 (d); 5,90 (m); 6,65 (br); 6,73 (d); 7,40 (d); 7,45 (s)
I-86	CH ₃	H	R3-63	R4-1	O	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,33 (m); 4,60 (m); 5,75 (m); 5,85 (m); 6,55 (s); 6,95 (s)
I-87	CH ₃	H	R3-64	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,14 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,35 (m); 4,63 (m); 5,85 (m); 6,15 (m); 6,27 (m); 6,55 (s); 6,97 (s)
I-88	CH ₃	H	R3-65	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,17 (s); 2,19 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,35 (m); 4,65 (m); 5,87 (m); 6,17 (m); 6,31 (m); 6,72 (d); 7,35 (d); 7,43 (s).
I-89	CH ₃	H	R3-66	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,14 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 3,97 (s); 4,32 (m); 5,87 (m); 6,57 (s); 6,65 (br); 6,97 (s)
I-90	CH ₃	H	R3-63	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,55 (m); 5,75 (m); 5,90 (m); 6,57 (s); 6,65 (br); 6,95 (s)
I-91	CH ₃	H	R3-67	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,18 (s); 2,20 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,60 (m); 5,75 (m); 5,90 (m); 6,55 (br); 6,73 (m); 7,35 (m); 7,43 (s)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-92	CH ₃	H	R3-64	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,60 (m); 5,87 (m); 6,15 (m); 6,27 (m); 6,57 (s); 6,65 (br); 6,95 (s)
I-93	CH ₃	H	R3-65	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,19 (s); 2,21 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,65 (m); 5,90 (m); 6,17 (m); 6,31 (m); 6,65 (br); 6,75 (d); 7,35 (m); 7,43 (s)
I-94	CH ₃	H	R3-59	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,33 (m); 4,63 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,53 (s); 6,97 (s)
I-95	CH ₃	H	R3-60	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,22 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,37 (m); 4,67 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,70 (d); 7,37 (m); 7,45 (s)
I-96	CH ₃	H	R3-61	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,17 (s); 2,28 (s); 3,87 (s); 4,07 (s); 4,33 (m); 4,67 (s); 5,40 (d); 5,43 (d); 5,87 (m); 6,53 (s); 6,95 (s)
I-97	CH ₃	H	R3-62	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,21 (s); 2,23 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,37 (m); 4,70 (s); 5,39 (d); 5,42 (d); 5,87 (m); 6,70 (d); 7,38 (m); 7,45 (s)
I-98	CH ₃	H	R3-68	R4-1	O	Y-1	δ = 1,23 (t); 1,87 (s); 2,08 (s); 2,27 (s); 3,70 (s); 3,95 (s); 4,10 (q); 4,30 (m); 5,90 (m); 6,65 (s); 7,00 (s)
I-99	CH ₃	H	R3-69	R4-1	O	Y-1	
I-100	CH ₃	H	R3-69	R4-1	NH	Y-1	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-101	CH ₃	H	R3-69	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-102	CH ₃	H	R3-70	R4-1	O	Y-6	
I-103	CH ₃	H	R3-70	R4-1	NH	Y-6	
I-104	CH ₃	H	R3-70	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-6	
I-105	CH ₃	H	R3-71	R4-1	O	Y-4	
I-106	CH ₃	H	R3-71	R4-1	NH	Y-4	
I-107	CH ₃	H	R3-71	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-4	
I-108	CH ₃	H	R3-72	R4-1	NH	Y-1	
I-109	CH ₃	H	R3-72	R4-1	O	Y-1	
I-110	CH ₃	H	R3-72	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-111	CH ₃	H	R3-72	R4-1	NH	Y-2	
I-112	CH ₃	H	R3-72	R4-1	O	Y-2	
I-113	CH ₃	H	R3-72	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-2	
I-114	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-2	
I-115	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	NH	Y-2	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-116	CH ₃	H	R3-1	R4-3	O	Y-2	
I-117	CH ₃	H	R3-1	R4-3	NH	Y-2	
I-118	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-2	
I-119	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-2	
I-120	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-2	
I-121	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-2	
I-122	CH ₃	H	R3-1	R4-7		Y-2	
I-123	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = CH ₃	O	Y-2	
I-124	CH ₃	H	R3-73	R4-1	NH	Y-1	
I-125	CH ₃	H	R3-74	R4-1	NH	Y-1	
I-126	CH ₃	H	R3-75	R4-1	NH	Y-1	
I-127	CH ₃	H	R3-76	R4-1	NH	Y-1	
I-128	CH ₃	H	R3-77	R4-1	NH	Y-1	
I-129	CH ₃	H	R3-78	R4-1	NH	Y-1	
I-130	CH ₃	H	R3-78	R4-1	NH	Y-1	
I-131	CH ₃	H	R3-80	R4-1	NH	Y-1	
I-132	CH ₃	H	R3-81	R4-1	NH	Y-1	
I-133	CH ₃	H	R3-82	R4-1	NH	Y-1	
I-134	CH ₃	H	R3-83	R4-1	NH	Y-1	
I-135	CH ₃	H	R3-84	R4-1	NH	Y-1	
I-136	CH ₃	H	R3-85	R4-1	NH	Y-1	
I-137	CH ₃	H	R3-86	R4-1	NH	Y-1	
I-138	CH ₃	H	R3-87	R4-1	NH	Y-1	
I-139	CH ₃	H	R3-88	R4-1	NH	Y-1	
I-140	CH ₃	H	R3-89	R4-1	NH	Y-1	
I-141	CH ₃	H	R3-90	R4-1	NH	Y-1	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-142	CH ₃	H	R3-91	R4-1	NH	Y-1	
I-143	CH ₃	H	R3-92	R4-1	NH	Y-1	
I-144	CH ₃	H	R3-93	R4-1	NH	Y-1	
I-145	CH ₃	H	R3-94	R4-1	NH	Y-1	
I-146	CH ₃	H	R3-95	R4-1	NH	Y-1	
I-147	CH ₃	H	R3-96	R4-1	NH	Y-1	
I-148	CH ₃	H	R3-97	R4-1	NH	Y-1	
I-149	CH ₃	H	R3-98	R4-1	NH	Y-1	
I-150	CH ₃	H	R3-99	R4-1	NH	Y-1	
I-151	CH ₃	H	R3-100	R4-1	NH	Y-1	
I-152	CH ₃	H	R3-101	R4-1	NH	Y-1	
I-153	CH ₃	H	R3-102	R4-1	NH	Y-1	
I-154	CH ₃	H	R3-103	R4-1	NH	Y-1	
I-155	CH ₃	H	R3-104	R4-1	NH	Y-1	
I-156	CH ₃	H	R3-105	R4-1	NH	Y-1	
I-157	CH ₃	H	R3-106	R4-1	NH	Y-1	
I-158	CH ₃	H	R3-107	R4-1	NH	Y-1	
I-159	CH ₃	H	R3-108	R4-1	NH	Y-1	
I-160	CH ₃	H	R3-109	R4-1	NH	Y-1	
I-161	CH ₃	H	R3-110	R4-1	NH	Y-1	
I-162	CH ₃	H	R3-111	R4-1	NH	Y-1	
I-163	CH ₃	H	R3-112	R4-1	NH	Y-1	
I-164	CH ₃	H	R3-113	R4-1	NH	Y-1	
I-165	CH ₃	H	R3-114	R4-1	NH	Y-1	
I-166	CH ₃	H	R3-115	R4-1	NH	Y-1	
I-167	CH ₃	H	R3-116	R4-1	NH	Y-1	
I-168	CH ₃	H	R3-117	R4-1	NH	Y-1	
I-169	CH ₃	H	R3-118	R4-1	NH	Y-4	

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-170	CH ₃	H	R3-119	R4-1	NH	Y-4	
I-171	CH ₃	H	R3-120	R4-1	NH	Y-4	
I-172	CH ₃	H	R3-121	R4-1	NH	Y-4	
I-173	CH ₃	H	R3-122	R4-1	NH	Y-4	
I-174	CH ₃	H	R3-123	R4-1	NH	Y-4	
I-175	CH ₃	H	R3-124	R4-1	NH	Y-4	
I-176	CH ₃	H	R3-125	R4-1	NH	Y-4	
I-177	CH ₃	H	R3-126	R4-1	NH	Y-1	
I-178	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-179	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-180	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-181	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-182	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	
I-183	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	
I-184	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-1	
I-185	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-1	
I-186	CH ₃	H	R3-127	R4-1	O	Y-1	79-81°C
I-187	CH ₃	H	R3-127	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,18 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 3,98 (s); 4,35 (m); 5,90 (m); 6,65 (br); 7,35 (d); 7,43 (s)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-188	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	δ = 1,05 (m); 2,30 (m); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,90 (m); 7,35 (m); 7,52 (m); 7,70 (d)
I-189	CH ₃	H	R3-127	R4-4, R ⁵ = CH ₃	O	Y-1	δ = 1,90 (s); 2,22 (s); 2,24 (s); 3,02 (s); 3,70 (s); 3,98 (s); 4,48 (m); 5,57 (m); 6,75 (m); 7,40 (m); 7,45 (s)
I-190	CH ₃	H	R3-66	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,10 (s); 2,13 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 3,92 (s); 4,05 (s); 4,35 (m); 5,87 (m); 6,53 (s); 6,97 (s)
I-191	CH ₃	H	R3-128	R4-1	O	Y-1	δ = 1,30 (t); 1,95 (s); 2,20 (s); 2,22 (s); 3,85 (s); 4,06 (s); 4,20 (q); 4,37 (m); 5,87 (m); 6,71 (d); 7,37 (m); 7,45 (s)
I-192	CH ₃	H	R3-128	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,30 (t); 1,95 (s); 2,20 (s); 2,21 (s); 2,92 (d); 3,95 (s); 4,22 (m); 4,37 (m); 5,90 (m); 6,65 (br); 6,73 (m); 7,37 (m); 7,45 (s)
I-193	CH ₃	H	R3-68	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,32 (t); 1,95 (s); 2,16 (s); 2,17 (s); 2,32 (s); 2,92 (d); 3,97 (s); 4,20 (q); 4,33 (m); 5,90 (m); 6,57 (s); 6,65 (br); 7,97 (s)
I-194	CH ₃	H	R3-5	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,53 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 7,07 (m); 7,25 (m); 7,55 (m); 7,63 (d)
I-195	CH ₃	H	R3-6	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,55 (m); 5,88 (d); 5,93 (m); 7,33 (m); 7,48 (s); 7,53 (d); 7,70 (d)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-196	CH ₃	H	R3-2	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,87 (d); 5,92 (m); 6,95 (m); 7,73 (d); 7,80 (m)
I-197	CH ₃	H	R3-4	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,37 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,85 (d); 5,92 (m); 7,12 (m); 7,28 (m); 7,43 (d); 7,67 (d)
I-198	CH ₃	H	R3-22	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,35 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,57 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 7,20 (d); 7,47 (d); 7,66 (d)
I-199	CH ₃	H	R3-24	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,60 (m); 5,95 (m); 7,67 (m); 7,77 (d)
I-200	CH ₃	H	R3-22	R4-1	O	Y-1	δ = 1,25 (m); 1,95 (s); 2,65 (m); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,58 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 7,25 (m); 7,48 (m); 7,67 (d)
I-201	CH ₃	H	R3-19	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 7,15 (m); 7,30 (m); 7,45 (m); 7,63 (s); 7,70 (d)
I-202	CH ₃	H	R3-7	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 7,45 (m); 7,67 (d); 7,73 (d)
I-203	CH ₃	H	R3-129	R4-1	O	Y-1	δ = 1,35 (d); 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,84 (d); 5,93 (m); 6,92 (m); 7,45 (m); 7,60 (d)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-204	CH ₃	H	R3-11	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,32 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 7,15 (d); 7,30 (m); 7,37 (s); 7,66 (d)
I-205	CH ₃	H	R3-3	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,54 (m); 5,82 (d); 5,92 (m); 6,95 (m); 7,25 (m); 7,32 (d)
I-206	CH ₃	H	R3-9	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,31 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,56 (m); 5,85 (m); 5,95 (m); 7,03 (m); 7,33 (m); 7,43 (m); 7,64 (m).
I-207	CH ₃	H	R3-18	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 7,05 (m); 7,33 (m); 7,55 (m); 7,65 (d)
I-208	CH ₃	H	R3-129	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,33 (d); 1,95 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,55 (m); 5,84 (m); 5,95 (m); 6,73 (br); 6,92 (d); 7,45 (d); 7,62 (m)
I-209	CH ₃	H	R3-58	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,43 (d); 7,55 (d); 8,23 (s)
I-210	Cl	CH ₃	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,10 (s); 2,65 (d); 4,01 (s); 4,95 (s); 5,97 (d); 6,85 (br); 7,37 (d); 7,50 (d); 7,67 (d)
I-211	vòng phenyl*		R3-1	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	90°C

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-212	vòng phenyl*		R3-98	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	151°C
I-213	vòng phenyl*		R3-130	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-4	
I-214	vòng phenyl*		R3-131	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-4	139-142°C
I-215	vòng phenyl*		R3-132	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-4	58-63°C
I-216	vòng phenyl*		R3-133	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	111-113°C
I-217	vòng phenyl*		R3-65	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	78-88°C
I-218	vòng phenyl*		R3-60	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	83-88°C
I-219	vòng phenyl*		R3-67	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	87-89°C
I-220	vòng phenyl*		R3-62	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	82-88°C

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-221	vòng phenyl*		R3-134	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	92-98°C
I-222	vòng phenyl*		R3-135	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	141-145°C
I-223	vòng phenyl*		R3-64	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	88-91°C
I-224	vòng phenyl*		R3-59	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	82-86°C
I-225	vòng phenyl*		R3-63	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	64-70°C
I-226	vòng phenyl*		R3-136	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	101-108°C
I-227	vòng phenyl*		R3-137	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	98-102°C
I-228	vòng phenyl*		R3-138	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	71-75°C
I-229	vòng phenyl*		R3-139	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-7	72-74°C

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-230	vòng phenyl*		R3-140	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-7	δ = 1,65 (s); 3,32 (s); 3,67 (s); 5,20 (s); 7,07 (m); 7,27 (m); 7,47 (m)
I-231	vòng phenyl*		R3-141	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	136-138°C
I-232	vòng phenyl*		R3-142	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-7	δ = 1,65 (s); 3,43 (s); 3,70 (s); 5,20 (s); 7,30-7,65 (m)
I-233	vòng phenyl*		R3-127	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,678 phút
I-234	vòng phenyl*		R3-143	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,092 phút
I-235	vòng phenyl*		R3-144	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,065 phút
I-236	vòng phenyl*		R3-145	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,947 phút
I-237	vòng phenyl*		R3-146	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,875 phút
I-238	vòng phenyl*		R3-147	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,100 phút

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-239	vòng phenyl*		R3-68	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,933 phút
I-240	vòng phenyl*		R3-148	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-4	R _t = 3,496 phút
I-241	vòng phenyl*		R3-149	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-4	R _t = 4,075 phút
I-242	vòng phenyl*		R3-150	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,128 phút
I-243	vòng phenyl*		R3-151	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,894 phút
I-244	vòng phenyl*		R3-152	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,875 phút
I-245	vòng phenyl*		R3-153	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,995 phút
I-246	vòng phenyl*		R3-154	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,115 phút
I-247	vòng phenyl*		R3-20	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,715 phút

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-248	vòng phenyl*		R3-157	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,714 phút
I-249	vòng phenyl*		R3-128	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,861 phút
I-250	vòng phenyl*		R3-158	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,251 phút
I-251	vòng phenyl*		R3-159	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	105-107°C
I-252	vòng phenyl*		R3-151	R4-7 R ⁶ =Et yl		Y-1	102-104°C
I-253	vòng phenyl*		R3-1	R4-7 R ⁶ =C HF ₂		Y-1	96-97°C
I-254	vòng phenyl*		R3-128	R4-7 R ⁶ =Et yl		Y-1	R _t = 4,219 phút
I-255	vòng phenyl*		R3-68	R4-7 R ⁶ =Et yl		Y-1	R _t = 4,239 phút
I-256	vòng phenyl*		R3-146	R4-7 R ⁶ =Et yl		Y-1	R _t = 4,176 phút

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-257	vòng phenyl*		R3-66	R4-7 R ⁶ =Et yl		Y-1	R _t = 4,013 phút
I-258	vòng phenyl*		R3-160	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,15 (s); 3,67 (s); 3,95 (s); 5,28 (s); 6,85 (m); 7,45 (m); 7,50 (m); 7,70 (m)
I-259	vòng phenyl*		R3-161	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 1,33 (t); 2,17 (s); 3,68 (s); 4,22 (q); 5,28 (s); 6,87 (d); 7,45 (m); 7,52 (m); 7,73 (m)
I-260	vòng phenyl*		R3-162	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,924 phút
I-261	vòng phenyl*		R3-163	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,131 phút
I-262	vòng phenyl*		R3-164	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,141 phút
I-263	vòng phenyl*		R3-165	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 3,916 phút
I-264	vòng phenyl*		R3-166	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,220 phút
I-265	vòng phenyl*		R3-167	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	R _t = 4,050 phút

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-266	vòng phenyl*		R3-149	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-8	δ = 2,03 (s); 3,71 (s); 7,45-7,62 (m)
I-267	vòng phenyl*		R3-168	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,20 (s); 2,40 (s); 3,69 (s); 5,20 (s); 6,70 (s); 7,12 (s); 7,42 (s); 7,53 (m); 7,72 (m); 7,91 (s)
I-268	vòng phenyl*		R3-169	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,11 (s); 2,18 (s); 3,62 (s); 3,72 (s); 5,21 (s); 6,77 (s); 6,96 (s); 7,25 (s); 7,53 (m); 7,72 (m); 8,91 (s)
I-269	vòng phenyl*		R3-170	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,00 (s); 2,05 (s); 2,16 (s); 2,21 (s); 3,70 (s); 5,16 (s); 6,72 (s); 6,82 (s); 7,50 (m); 7,74 (m)
I-270	vòng phenyl*		R3-171	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,16 (s); 2,39 (s); 2,53 (s); 3,70 (s); 5,19 (s); 6,70 (s); 7,53 (m); 7,72 (m)
I-271	vòng phenyl*		R3-172	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 2,18 (s); 2,29 (s); 3,70 (s); 5,18 (s); 6,71 (s); 7,06 (s); 7,50 (m); 7,71 (m); 8,38 (s); 8,44 (s)
I-272	vòng phenyl*		R3-173	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 1,28 (m); 2,12 (s); 3,00 (rộng); 3,58 (m); 3,69 (s); 5,52 (s); 6,28 (s); 7,45 (m); 7,72 (m)
I-273	vòng phenyl*		R3-174	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-1	δ = 0,97 (m); 1,02 (m); 1,20 (m); 1,90 (m); 2,05 (s); 2,62 (m); 3,68 (s); 5,51 (s); 5,84 (s); 7,50 (m); 7,73 (m)
I-274	vòng phenyl*		R3-175	R4-7 R ⁶ =C H ₃		Y-8	R _t = 3,715 phút

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-275	CH ₃	H	R3-20	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 7,45 (m); 7,52 (m); 7,75 (m); 7,84 (d)
I-276	CH ₃	H	R3-12	R4-1	O	Y-1	72-74°C
I-277	CH ₃	H	R3-15	R4-1	O	Y-1	73-75°C
I-278	CH ₃	H	R3-176	R4-1	O	Y-1	δ = 1,97 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (d); 5,90 (d); 5,95 (m); 7,17 (t); 7,43 (m); 7,65 (m)
I-279	CH ₃	H	R3-98	R4-1	O	Y-1	90-92°C
I-280	CH ₃	H	R3-20	R4-1	NH	Y-1	101-103°C
I-281	CH ₃	H	R3-12	R4-1	NH	Y-1	112-115°C
I-282	CH ₃	H	R3-15	R4-1	NH	Y-1	93-95°C
I-283	CH ₃	H	R3-176	R4-1	NH	Y-1	84-86°C
I-284	CH ₃	H	R3-98	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,93 (d); 3,97 (s); 4,48 (m); 5,93 (m); 6,42 (m); 6,67 (rộng); 6,80 (d); 7,37 (d); 7,45 (m); 7,68 (m); 7,83 (m)
I-285	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d)
I-286	CH ₃	H	R3-51	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,45 (s); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,60 (d); 5,92 (t); 7,25-7,50 (m)
I-287	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,05 (t); 2,30 (q); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,93 (m); 6,70 (rộng); 7,35 (m); 7,53 (m); 7,68 (s)
I-288	CH ₃	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,63 (m); 5,95 (m); 6,75 (rộng); 7,43 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-289	CH ₃	H	R3-51	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,45 (s); 2,83 (d); 3,95 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 6,73 (rộng); 7,30-7,50 (m)
I-290	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = C ₂ H ₅	O	Y-1	δ = 1,18 (m); 1,95 (s); 3,45 (rộng); 3,73 (s); 4,67 (m); 5,70 (m); 5,90 (m); 7,35 (m); 7,53 (m); 7,67 (m)
I-291	CH ₃	H	R3-39	R4-1	O	Y-1	72°C
I-292	CH ₃	H	R3-44	R4-1	O	Y-1	106-110°C
I-293	CH ₃	H	R3-44	R4-1	NH	Y-1	177°C
I-294	CH ₃	H	R3-177	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,20 (m); 3,28 (m); 3,83 (s); 3,90 (m); 4,05 (s); 4,42 (m); 4,50 (m); 5,88 (m); 5,94 (s); 6,83 (m); 7,25 (m); 7,50 (s)
I-295	CH ₃	H	R3-39	R4-1	NH	Y-1	142°C
I-296	Iso-butyl	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	δ = 0,93 (m); 1,60 (m); 2,15 (d); 3,84 (s); 4,07 (s); 4,62 (m); 5,89 (m); 7,35 (d); 7,53 (d); 7,67 (s)
I-297	CH ₃	H	R3-29	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,27 (m); 7,87 (m); 8,35 (s)
I-298	CH ₃	H	R3-36	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,63 (m); 7,67 (m); 7,93 (s); 8,37 (s)
I-299	Iso-butyl	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	177°C
I-300	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	O	Y-1	87°C
I-301	CH ₃	H	R3-29	R4-1	NH	Y-1	140°C
I-302	CH ₃	H	R3-36	R4-1	NH	Y-1	125°C

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-303	CH ₃	H	R3-33	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,37 (m); 7,57 (m); 8,27 (s)
I-304	CH ₃	H	R3-54	R4-1	O	Y-1	δ = 1,25 (m); 1,95 (s); 2,68 (m); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,30 (m); 7,51 (m); 8,20 (s)
I-305	CH ₃	H	R3-33	R4-1	NH	Y-1	126°C
I-306	CH ₃	H	R3-54	R4-1	NH	Y-1	128°C
I-307	CH ₃	H	R3-178	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 3,82 (s); 4,07 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,28 (m); 7,36 (m); 7,93 (s)
I-308	CH ₃	H	R3-130	R4-1	O	Y-4	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,55 (m); 5,90 (m); 7,25-7,60 (m); 7,77 (m); 7,85 (s); 8,05 (s); 8,27 (s)
I-309	CH ₃	H	R3-130	R4-1	NH	- CH =N -O- CH 2-	δ = 1,95 (s); 2,88 (d); 3,96 (s); 4,50 (m); 5,92 (m); 6,70 (rộng); 7,25-7,60 (m); 7,76 (m); 8,05 (s); 8,08 (s); 8,27 (s)
I-310	CH ₃	H	R3-42	R4-1	O	Y-1	116°C
I-311	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	154°C
I-312	CH ₃	H	R3-30	R4-1	NH	Y-1	167°C
I-313	CH ₃	H	R3-178	R4-1	NH	Y-1	143°C
I-314	CH ₃	H	R3-42	R4-1	NH	Y-1	147°C
I-315	CH ₃	H	R3-40	R4-1	NH	Y-1	153°C

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-316	CH ₃	H	R3-177	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,88 (d); 3,20 (m); 3,28 (m); 3,90 (m); 3,95 (s); 4,42 (m); 4,50 (m); 5,90 (m); 5,95 (s); 6,67 (rộng); 6,86 (m); 7,25 (m); 7,50 (s)
I-317	CH ₃	H	R3-179	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,83 (s); 1,93 (s); 2,18 (s); 2,42 (m); 2,70 (m); 2,88 (d); 3,83 (s); 3,95 (s); 4,35 (m); 5,90 (m); 6,65 (m); 6,93 (m)
I-318	CH ₃	H	R3-38	R4-1	O	Y-1	87°C
I-319	CH ₃	H	R3-32	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,27 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,30 (m); 7,93 (s)
I-320	CH ₃	H	R3-34	R4-1	NH	Y-1	120°C
I-321	CH ₃	H	R3-38	R4-1	NH	Y-1	143°C
I-322	CH ₃	H	R3-37	R4-1	NH	Y-1	117°C
I-323	CH ₃	H	R3-40	R4-1	O	Y-1	118°C
I-324	CH ₃	H	R3-37	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,23 (s); 2,35 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,15 (m); 7,91 (s)
I-325	CH ₃	H	R3-43	R4-1	NH	Y-1	136°C
I-326	CH ₃	H	R3-34	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,63 (m); 5,95 (m); 7,67 (m); 7,82 (m); 8,42 (s)
I-327	CH ₃	H	R3-32	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,07 (s); 2,42 (s); 2,92 (d); 4,08 (s); 4,78 (m); 6,08 (m); 6,93 (rộng); 7,45 (m); 8,08 (s)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-328	CH ₃	H	R3-41	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,65 (m); 5,93 (m); 6,73 (rộng); 7,30 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)
I-329	CH ₃	H	R3-28	R4-1	NH	Y-1	94°C
I-330	CH ₃	H	R3-50	R4-1	NH	Y-1	130°C
I-331	CH ₃	H	R3-41	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,87 (s); 4,06 (s); 4,63 (m); 5,93 (m); 7,32 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)
I-332	C ₂ H ₅	H	R3-2	R4-1	O	Y-1	δ = 1,05 (t); 2,30 (m); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,62 (d); 5,90 (m); 6,93 (m); 7,73 (m); 7,80 (m)
I-333	CH ₃	H	R3-180	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,40 (m); 5,88 (m); 6,66 (d); 6,78 (m); 7,37 (m); 7,45 (m); 7,83 (d)
I-334	CH ₃	H	R3-77	R4-1	O	Y-1	123-124°C
I-335	CH ₃	H	R3-119	R4-1	O	Y-4	δ = 1,90 (s); 2,12 (s); 3,83 (s); 3,92 (s); 4,03 (s); 4,33 (m); 5,74 (m); 7,18-7,45 (m)
I-336	CH ₃	H	R3-80	R4-1	O	Y-1	133-134°C
I-337	CH ₃	H	R3-180	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,40 (m); 5,88 (m); 6,66 (rộng); 6,82 (m); 7,37 (m); 7,45 (m); 7,81 (d)
I-338	CH ₃	H	R3-79	R4-1	O	Y-1	94-97°C
I-339	CH ₃	H	R3-119	R4-1	NH	Y-4	δ = 1,90 (s); 2,12 (s); 2,85 (d); 3,92 (s); 4,33 (m); 5,75 (m); 6,60 (rộng); 7,18-7,45 (m)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-340	CH ₃	H	R3-130	R4-1	O	- CH =N -O- CH 2-	δ = 1,95 (s); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,52 (m); 5,87 (m); 7,25-7,60 (m); 7,75 (m); 7,80 (s); 8,05 (s); 8,26 (s)
I-341	CH ₃	H	R3-130	R4-1	NH	Y-4	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,83 (d); 3,97 (s); 4,54 (m); 5,93 (m); 6,75 (rộng); 7,25-7,60 (m); 7,77 (m); 7,82 (s); 8,02 (s); 8,29 (s)
I-342	CH ₃	H	R3-181	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,88 (d); 3,97 (s); 4,39 (m); 5,93 (m); 6,67 (rộng); 6,80 (m); 7,08 (m); 7,27 (m); 7,45 (m)
I-343	CH ₃	H	R3-182	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,91 (d); 3,98 (s); 4,41 (m); 5,93 (m); 6,70 (rộng); 6,85 (m); 7,37 (m); 7,65 (m)
I-344	CH ₃	H	R3-183	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,91 (d); 3,98 (s); 4,40 (m); 5,93 (m); 6,66 (rộng); 6,83 (m); 7,25-7,46 (m)
I-345	CH ₃	H	R3-184	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,90 (d); 3,85 (s); 3,98 (s); 4,38 (m); 5,93 (m); 6,66 (rộng); 6,82 (m); 7,30 (m)
I-346	CH ₃	H	R3-185	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,20 (s); 2,88 (d); 3,95 (s); 4,30 (m); 4,98 (s); 5,92 (m); 6,65 (m); 6,80 (m); 7,40 (m)
I-347	CH ₃	H	R3-69	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,65 (m); 5,92 (m); 6,67 (rộng); 6,87 (m); 7,25 (m); 7,67 (m)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-348	CH ₃	H	R3-186	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,42 (m); 1,95 (s); 2,27 (s); 2,91 (d); 2,96 (m); 3,98 (s); 4,42 (m); 5,93 (m); 6,70 (rộng); 6,83 (m); 7,87 (m)
I-349	C ₂ H ₅	H	R3-5	R4-1	NH	Y-1	98°C
I-350	CH ₃	H	R3-88	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,53 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,50 (m); 5,65 (s); 5,90 (m); 7,28 (m); 7,50 (s)
I-351	CH ₃	H	R3-88	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,50 (s); 3,97 (s); 4,48 (m); 5,65 (m); 5,93 (m); 6,70 (rộng); 7,28 (m); 7,50 (s)
I-352	CH ₃	H	R3-76	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,63 (m); 5,93 (m); 6,66 (rộng); 7,35 (m); 7,77 (m)
I-353	CH ₃	H	R3-187	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,63 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 6,70 (rộng); 7,48 (m); 7,85 (m); 7,97 (d)
I-354	CH ₃	H	R3-188	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,77 (d); 3,93 (s); 4,54 (m); 5,92 (m); 6,80 (rộng); 7,33 (m); 7,45 (m)
I-355	CH ₃	H	R3-189	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,92 (m); 6,70 (rộng); 7,23 (m); 7,40 (m); 7,64 (s); 7,78 (d)
I-356	CH ₃	H	R3-193	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,94 (s); 2,87 (d); 3,94 (s); 4,44 (m); 5,17 (s); 5,67 (d); 5,88 (m); 6,70 (rộng); 6,86 (m); 7,20 (m); 7,37 (d)

Số	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	Điểm nóng chảy [°C]; ¹ H-NMR (δ); R _t [phút]
I-357	CH ₃	H	R3-194	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 6,75 (rộng); 7,25 (m); 7,35 (m); 7,45 (m); 7,55 (m); 7,70 (d)
I-358	CH ₃	H	R3-83	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,57 (m); 5,92 (m); 6,13 (s); 6,83 (rộng); 7,45 (m); 7,35 (m); 7,70 (m)
I-359	CH ₃	H	R3-195	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,50 (s); 2,88 (d); 3,95 (s); 4,57 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 6,70 (rộng); 6,90 (m); 7,60 (m); 8,33 (d)

* “vòng phenyl” có nghĩa là R¹ và R² cùng với hai nguyên tử cacbon liên kết với chúng để tạo thành vòng phenyl. Isobutyl = 2-metyl-1-propyl.

m.p. = điểm nóng chảy; R_t = thời gian lưu giữ HPLC.

Dữ liệu HPLC: cột RP-18 (Tốc độ in đá ROD 50x4,6mm từ Merck KGaA, Germany), 1,8 ml/phút, thể tích phun 2μl, nhiệt độ cột 40°C.

Dung môi rửa giải hấp: Axetonitril + 0,1% axit trifloaxetic (TFA) / nước + 0,1% TFA (% gradien: 95 đến 95:5 trong 5 phút), 40°C. MS: Quadrupole electrospray ionisation, 80 V (pos. mode).

II. Ví dụ về tác dụng chống lại nấm gây hại

Tác dụng diệt nấm của các hợp chất có công thức I được minh họa bởi các thí nghiệm sau đây:

II.1 Thí nghiệm vi chuẩn

Các hoạt chất được bào chế riêng lẻ như dung dịch gốc trong dimetyl sulfoxit (DMSO) với nồng độ 10 000ppm.

Ví dụ sử dụng 1: Hoạt tính chống lại tác nhân gây bệnh đốm vết Septoria gây ra bởi *Septoria tritici* trong thí nghiệm vi chuẩn

Các loại nấm được sử dụng:

- a) *Septoria tritici* (nhạy cảm với chất ức chế Qo, kiểu hoang)
- b) *Septoria tritici* (có khả năng chịu được chất ức chế Qo, đột biến G143A)

100ml phần chiết mạch nha 2% trong nước ở pH 6,8 được ghép với các tiểu bào tử được nuôi 2 tuần tuổi được trồng trên phần chiết mạch nha 2% + aga 2% trong các đĩa Petri và được nuôi cấy trong 3 ngày trên máy lắc quay ở nhiệt độ 24°C và với tốc độ 150 vòng/phút. Mẻ cấy được thu hoạch, glyxerol được bổ sung vào (15 % (v/v) và được giữ đông lạnh ở nhiệt độ -20°C trong các phân ước 1ml.

1ml huyền phù gốc được làm tan và được khuấy đục vào 800ml phần chiết mạch nha 2% trong nước ở pH 6,8. Các hợp chất được pha loãng từ dung dịch gốc trong (dimethylsulfoxit) DMSO trong 10 bước. Các dung dịch của hợp chất được pha loãng 1/5 với nước khử ion vô trùng trước khi sử dụng. 5µl dung dịch của hợp chất được chuyển sang các khay vi thể. Sau đó, các khay này được đổ đầy với 195µl huyền phù của tiểu bào tử của mỗi loại nấm.

Hoạt tính diệt nấm được xác định bằng cách đo độ đục của mẻ cấy trong các khay vi thể 96 lỗ với sự có mặt của các hợp chất thí nghiệm. Sự phát triển của nấm đo được bằng cách cứ từ 15 đến 150 giờ ghi lại độ đen ở 620nm. Hoạt tính diệt nấm tương ứng đo được bằng cách so sánh hiệu quả của các hợp chất thí nghiệm với hiệu quả của việc kiểm soát DMSO và thuốc diệt nấm tiêu chuẩn.

Giá trị IC_{50} (nồng độ của hợp chất thí nghiệm dẫn đến 50% sự ức chế đối với sự phát triển của nấm) đo được từ phản ứng liều lượng thu được đối với mỗi hợp chất và mỗi loại nấm. Nồng độ ban đầu của các hợp chất thí nghiệm và 10 bước pha loãng (mỗi hợp chất có tỷ lệ 1:4) cho phép các giá trị IC_{50} được đánh giá từ 0,001 đến 100µmol/l (µM).

Bảng II.

Hợp chất	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng (đột biến G143A) (R-IC ₅₀) [μM]	Tách <i>Septoria tritici</i> nhạy (kiểu hoang) (S-IC ₅₀) [μM]	Hệ số kháng RF = R-IC ₅₀ /S-IC ₅₀
Azoxystrobin	> 100	3,5	n.d.
Dimoxystrobin	> 100	7,1	n.d.
Enestroburin	> 100	4,5	n.d.
Kresoximmethyl	> 100	0,76	n.d.
Metominostrobin	> 100	> 100	n.d.
Orysastrobin	> 100	27	n.d.
Picoxystrobin	> 100	2,3	n.d.
Pyrametostrobin	> 100	> 100	n.d.
Pyraoxystrobin	> 100	1,6	n.d.
Pyraclostrobin	3,4	0,0012	2882
Trifloxystrobin	> 100	0,52	n.d.
I-5	2,2	0,083	26
I-6	8,3	0,34	24
I-82	6,8	1,1	6
I-83	7,6	1,6	4,6
I-84	16,1	0,5	33
I-85	22	0,8	29
I-90	26	1,0	26
I-91	27	1,6	17
I-94	12	0,6	22
I-95	29	2,2	14
I-97	49	1,7	29

Hợp chất	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng (đột biến G143A) (R-IC ₅₀) [μM]	Tách <i>Septoria tritici</i> nhạy (kiểu hoang) (S-IC ₅₀) [μM]	Hệ số kháng RF = R-IC ₅₀ /S-IC ₅₀
I-191	37	1,3	29
I-211	1,1	0,44	2,6
I-212	8,3	1,4	6
I-213	0,057	0,076	0,7
I-215	48	1,7	28
I-216	12,0	6,3	2,0
I-217	63	6,3	10
I-218	79	5,6	14
I-221	10	3,4	3
I-223	19	2,7	7
I-224	5,4	1,7	3,2
I-225	72	3,4	21
I-228	10	3,4	3,0
I-230	25	3,2	8
I-233	2,7	0,24	12
I-234	4	2,4	1,7
I-235	51	13	4
I-236	24	6	4
I-238	12	6	1,9
I-243	15	4,1	3,6
I-244	1,3	0,6	2,0
I-247	9	5	1,9
I-249	11	2,4	5
I-250	97	19	5

Hợp chất	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng (đột biến G143A) (R-IC ₅₀) [μM]	Tách <i>Septoria tritici</i> nhạy (kiểu hoang) (S-IC ₅₀) [μM]	Hệ số kháng RF = R-IC ₅₀ / S-IC ₅₀
I-255	42	19	2,2
I-256	24	21	1,1
I-257	67	15	4,5
I-260	3,3	2,3	1,4
I-261	5	2,9	1,6
I-262	1,6	1	1,6
I-265	4	3,8	1,1
I-267	5	2,9	1,7
I-269	74	8	10
I-270	57	6	10
I-271	7	1,9	3,9
I-273	22	5	4
I-274	19	9	2,0
I-287	18	1,5	12
I-288	28	3,5	8,0
I-291	18	1,0	18,0
I-292	33	7,9	4,2
I-298	31	3,6	8,6
I-303	4,6	0,27	17,0
I-304	9,1	0,53	17,2
I-305	32	9,3	3,4
I-307	67	19,0	3,5
I-310	11	0,39	28,2
I-319	102	17,0	6,0

Hợp chất	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng (đột biến G143A) (R-IC ₅₀) [μM]	Tách <i>Septoria tritici</i> nhạy (kiểu hoang) (S-IC ₅₀) [μM]	Hệ số kháng RF = R-IC ₅₀ / S-IC ₅₀
I-324	38	1,9	20,0
I-326	18	1,2	15,0
I-331	25	1,8	13,9
I-339	21	1,0	21,0

Trong khi các thuốc diệt nấm loại strobilurin bán sẵn trên thị trường không thể hiện hoạt tính bất kỳ chống lại *Septoria* có sức kháng, chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo (G143A) trong khi có hoạt tính chống lại các chủng kiểu hoang nhạy, các hợp chất có công thức I có hoạt tính chống lại cả hai, chủng có sức kháng và chủng kiểu hoang. Nói chung, tỷ lệ hệ số kháng (RF) được tính từ các giá trị IC₅₀ xác định cho cả hai chủng *Septoria*, là dưới 30 đối với các hợp chất có công thức I theo sáng chế. Tuy nhiên, trong phần lớn các trường hợp, tỷ lệ hệ số kháng đối với các hợp chất loại strobilurin bán sẵn trên thị trường là lớn hơn 100 và thường lớn hơn vài trăm (để biết thông tin chi tiết, tham khảo, ví dụ FRAC, Mutations associated with QoI-resistance, Dec. 2006; <http://frac.info/frac/work/Mutations%20associated%20with%20QoI%20resistance.pdf> và các trích dẫn trong tài liệu này).

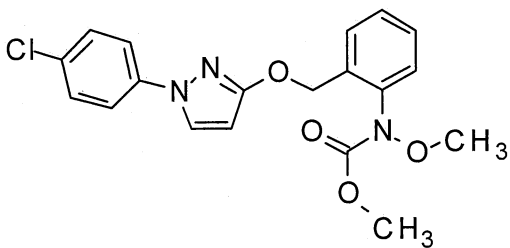
II.2 Ví dụ so sánh

A) Thí nghiệm trên cánh đồng

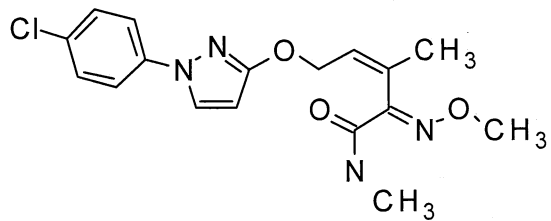
Các hợp chất được sử dụng:

Hợp chất có công thức I-6 được sử dụng là hợp phần EC 50g/l. Pyraclostrobin được sử dụng là sản phẩm HEADLINE bán sẵn trên thị trường.

Các hợp chất được sử dụng:



Pyraclostrobin



hợp chất I-6

Thí nghiệm 1: Tính hiệu quả chống lại *Septoria tritici* trên cây lúa mì mùa đông

Thí nghiệm được tiến hành dưới các điều kiện thực địa ở Böhl-Iggelheim, Rhineland-palatinate, Germany. Hạt giống của cây lúa mì mùa đông (cv. Riband) được gieo và được trồng dưới các điều kiện tiêu chuẩn với sự cung cấp đầy đủ của nước và chất dinh dưỡng. Ở giai đoạn phát triển GS 32 (14 tháng 04 năm 2011), xử lý hợp chất lần thứ nhất (200 g a.i./ha) được tiến hành với thể tích nước là 400L/ha, mà được lặp lại 21 ngày sau đó ở giai đoạn phát triển GS 39. Không xử lý tiếp bằng thuốc diệt nấm. Nhiễm tác nhân gây bệnh từ nấm (ví dụ, *Septoria tritici*) diễn ra tự nhiên. Sự đánh giá phạm vi ảnh hưởng của bệnh đối với *Septoria tritici* 20, 33 và 46 ngày sau lần xử lý cuối cùng (DAA) được thể hiện trong bảng III. Ở hàng cuối cùng, sự đánh giá về % tách *Septoria tritici* có sức kháng đối với chất ức chế Qo với đột biến G143A sau khi xử lý được đưa ra.

Bảng III.

Xử lý	Nồng độ (g a.i./ha)	Bệnh (%)			% đột biến G143A (%) khi tách <i>Sep- toria tritici</i>
		20 DAA	33 DAA	46 DAA	
Hợp chất I-6	200	1	6	36	100
Pyraclostrobin	200	8	32	93	100
không được xử lý	-	13	47	96	65

Trong thí nghiệm này, tác nhân gây bệnh từ nấm *Septoria tritici* được chọn lọc hoàn toàn theo hướng tách có sức kháng đối với chất ức chế Qo bằng mỗi một lần xử lý với các hợp chất tương tự strobilurin là Pyraclostrobin và hợp chất có công thức I-6. Do mức độ kháng cao, Pyraclostrobin thể hiện mức kiểm soát không đủ mặc dù nó được sử dụng ở mức

liều lượng bán sẵn trên thị trường, trong khi hợp chất có công thức I-6 có khả năng kiểm soát tách có sức kháng đối với chất ức chế Qo của *Septoria tritici* với đột biến G143.

Thí nghiệm 2: Tính hiệu quả chống lại *Septoria tritici* trên cây lúa mì mùa đông

Thí nghiệm này được tiến hành dưới các điều kiện thực địa ở Limburgerhof, Rhineland-Palatinate, Germany. Hạt giống của cây lúa mì mùa đông (cv. Riband) được gieo và được trồng dưới các điều kiện tiêu chuẩn với sự cung cấp đầy đủ của nước và chất dinh dưỡng. Ở giai đoạn phát triển GS 33 (08 tháng 04 năm 2011), xử lý hợp chất lần thứ nhất (200 g a.i./ha) được tiến hành với thể tích nước là 400L/ha, mà được lặp lại 26 ngày sau đó ở giai đoạn phát triển GS 39. Không xử lý tiếp bằng thuốc diệt nấm. Nhiễm tác nhân gây bệnh từ nấm (ví dụ, *Septoria tritici*) diễn ra tự nhiên. Sự đánh giá phạm vi ảnh hưởng của bệnh đối với *Septoria tritici* 19 và 34 ngày sau lần xử lý cuối cùng (DAA) được thể hiện trong bảng IV. Ở hàng cuối cùng, sự đánh giá về % tách *Septoria tritici* có sức kháng đối với chất ức chế Qo với đột biến G143A sau khi xử lý được đưa ra.

Bảng IV.

Xử lý	Nồng độ (g a.i./ha)	Bệnh (%)		% đột biến G143A (%) khi tách <i>Septoria tritici</i>
		19 DAA	34 DAA	
Hợp chất I-6	200	3	12	99
Pyraclostrobin	200	5	28	100
không được xử lý	-	10	36	94

Trong thí nghiệm này, khoảng toàn bộ tác nhân gây bệnh từ nấm *Septoria tritici* có sức kháng đối với chất ức chế Qo (như được đánh giá ở cuối thí nghiệm). Do mức độ kháng cao, Pyraclostrobin thể hiện hoạt tính chống nấm chỉ ở mức độ không đáng kể so với đối chứng không được xử lý mặc dù nó được sử dụng ở mức liều lượng bán sẵn trên thị trường. Tuy nhiên, hợp chất có công thức I-6 có khả năng làm giảm đáng kể sự nhiễm *Septoria tritici* có khả năng kháng đối với chất ức chế Qo với đột biến G143.

B) Thí nghiệm nhà kính

Dung dịch phun được điều chế trong một số bước:

Dung dịch gốc được điều chế như sau: 1,26ml của hỗn hợp xyclohexanon và dimetyl-sulfoxit tỷ lệ 1:1 được bổ sung vào 8,4mg thành phần hoạt tính. Tiếp theo, 40,74ml hỗn hợp nước, axeton (10%), chất nhũ tương Wettol (0,1%) và chất thấm ướt Silwet (0,05%) được bổ sung vào. Sau đó, dung dịch gốc này được pha loãng tiếp với hỗn hợp dung môi-chất nhũ tương-nước nêu trên đến nồng độ mong muốn.

Thí nghiệm 3: Kiểm soát bệnh đốm lá trên cây lúa mì do tách hai *Septoria tritici* chứa G143A trong gen sắc tố tế bào b của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ gây ra

Các cây lúa mì được trồng trong chậu. Các cây này được phun tràn huyền phù chứa nước, chứa nồng độ mong muốn của thành phần hoạt tính. Ngày tiếp theo, các cây được xử lý được cấy huyền phù chứa nước của *Septoria tritici*. Sau khi cấy, các cây thí nghiệm được đặt nắp và được chuyển ngay sang phòng có độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 83 đến 85% và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 19,5 đến 20°C. Sau 4 ngày, nắp được lấy ra. Nói chung, các cây thí nghiệm được trồng trong khoảng 28 ngày trong phòng nhà kính. Sau đó, mức độ tấn công của nấm trên lá được đánh giá bằng mắt là % vùng lá bị bệnh.

Bảng VII.

Xử lý	Nồng độ (ppm)	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng 1 (đột biến G143A) Mức độ nhiễm bệnh (%)	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng 2 (đột biến G143A) Mức độ nhiễm bệnh (%)
I-7	200	3	0
I-7	100	3	1
I-7	50	20	5
I-7	25	80	15
I-7	12,5	100	90
I-211	200	1	0
I-211	100	3	1
I-211	50	10	5
I-211	25	60	10
I-211	12,5	80	30

Xử lý	Nồng độ (ppm)	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng 1 (đột biến G143A) Mức độ nhiễm bệnh (%)	Tách <i>Septoria tritici</i> có khả năng kháng 2 (đột biến G143A) Mức độ nhiễm bệnh (%)
I-14	200	3	1
I-14	100	15	5
I-14	50	70	15
I-14	25	80	70
I-14	12,5	100	90
I-6	200	1	0
I-6	100	3	3
I-6	50	3	3
I-6	25	10	15
I-6	12,5	50	20
I-11	200	1	1
I-11	100	3	5
I-11	50	30	30
I-11	25	90	50
I-11	12,5	100	70
Pyraclostrobin	200	30	15
Pyraclostrobin	100	90	25
Pyraclostrobin	50	100	40
Pyraclostrobin	25	100	60
Pyraclostrobin	12,5	100	60
Trifloxystrobin	200	90	60
Trifloxystrobin	100	90	70
Trifloxystrobin	50	90	70
Trifloxystrobin	25	100	70
Trifloxystrobin	12.5	100	80

III. Mô hình phân tử

III.1 Mô hình cấu trúc của vị trí liên kết kiểu hoang và đột biến G143A

Mô hình cấu trúc của vị trí liên kết kiểu hoang và phức hệ sắc tố tế bào bc₁ G143A được tạo ra dựa trên cấu trúc tinh thể của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ của bò với azoxystrobin được liên kết với vị trí Qo (PDB: 1SQB: Esser et al. J Mol Biol 341, 281-302 (2004)).

Kết cấu này được đưa vào Schrödinger Maestro (version 9.0, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

Sắc tố tế bào b được tách từ cấu trúc của phức hệ và được xử lý với Schrödinger Protein Preparation Wizard (Schrödinger Suite 2009 Protein Preparation Wizard; Epik version 2.0, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009; Impact version 5.5, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009, Prime version 2.1, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

Cấu trúc này được sử dụng như là mô hình của vị trí liên kết kiểu hoang mà không cần phải thay đổi thêm.

Mô hình đột biến G143A được tạo ra bằng cách thay đổi hydro trong Glyxin 143 của mô hình kiểu hoang vào nhóm metyl, nhờ đó tạo ra S-Alanin, bằng cách sử dụng Schrödinger Maestro. Các axit amin trong khối cầu 5 Å quanh phân tử đồng kết tinh của azoxystrobin được giảm thiểu năng lượng bằng cách sử dụng Schrödinger MacroModel (version 9.7, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

III.2 Nối phân tử

Cấu trúc của các chất ức chế được điều chế để nối với Schrödinger LigPrep (version 2.3, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009) và được đưa vào mô hình cấu trúc bằng cách sử dụng Schrödinger Glide (version 5.5, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

III.3 Biểu đồ của các chất ức chế được liên kết với phức hệ sắc tố tế bào bc₁

Biểu diễn đồ họa các kiểu nối được tạo ra bằng cách sử dụng Molecular Operating Environment (MOE; 2010.10; Chemical Computing Group Inc., 1010 Sherbooke St.

West, Suite #910, Montreal, QC, Canada, H3A 2R7, 2010) và được lọc bằng cách sử dụng GNU Image Manipulation Program (GIMP, version 2.6.8, 2008).

Như được minh họa trên Fig. 1, mô hình phân tử của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ có khả năng chịu được chất ức chế Qo nhân tạo với đột biến G143A (xem chi tiết dưới đây) được thực hiện. Nối pyraclostrobin của hợp chất tương tự strobilurin bán sẵn trên thị trường thể hiện sự va chạm về không gian dẫn đến liên kết yếu của thành phần hoạt tính này trong phức hệ sắc tố tế bào bc₁ với đột biến G143A. Các hợp chất theo sáng chế tránh được sự va chạm về không gian bằng cách hoặc thay thế vòng phenyl trung tâm của pyraclostrobin bằng hai đơn vị cacbon nhỏ hơn và/hoặc linh hoạt hơn mà có thể được thể một cách thích hợp hoặc bằng cách thay thế các tính được đã biết bằng một phân tử tetrazolinon R4-7 nhỏ hơn.

III.4 Số lần va chạm Van-der-Waals giữa các chất ức chế và Alanin G143A

Các phối tử được đưa vào được chuyển sang mô hình vị trí liên kết G143A để giữ không cho các tọa độ được đưa vào mô hình kiểu hoang. Nhờ đó, các phức hệ giữa vị trí liên kết G143A và các phối tử được tạo thành. Chúng được sử dụng làm cấu trúc khởi mào để giảm thiểu năng lượng bằng cách sử dụng Schrödinger MacroModel. Trong khi mô hình hóa, chỉ có phối tử được cho phép di chuyển tự do, protein được cho là “đóng băng”. Các kiểu được tạo ra bởi quy trình này được xem là trạng thái thoải mái của các chất ức chế sau khi đưa vào đột biến G143A.

Hai nguyên tử được xem là có sự va chạm về không gian, nếu khoảng cách giữa các tâm của chúng nhỏ hơn 0,9 lần tổng bán kính Van-der-Waals của chúng. Đối với các cặp nguyên tử tương ứng với sự tương tác của strobilurin với Alanin 143, khoảng cách tương ứng được mô tả trong Bảng V.

Bảng V.

Nguyên tử 1	Bán kính vdW 1	Nguyên tử 2	Bán kính vdW 2	Tổng vdW	Khoảng cách va chạm
C	1,70	C	1,70	3,40	3,06
C	1,70	N	1,55	3,25	2,93

C	1,70	O	1,52	3,22	2,90
C	1,70	H	1,20	2,90	2,61
H	1,20	N	1,55	2,75	2,48
H	1,20	O	1,52	2,72	2,45

Sau khi giảm thiểu ở vị trí liên kết G143A như được mô tả trên đây, số lần va chạm về không gian Van-der-Waals với Alanin 143 được đếm đối với mỗi một chất ức chế. Kết quả được đưa ra trong Bảng VI.

Bảng VI.

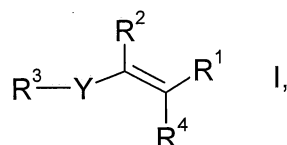
Hợp chất	Số lần va chạm
I-5	3
I-6	3
Pyrametostrobin	6
Metominostrobin	6
Azoxystrobin	7
Enestroburin	7
Pyraclostrobin	7
Dimoxystrobin	7
Orysastrobin	7
Pyraoxystrobin	8
Picoxystrobin	8
Trifloxystrobin	8
Kresoxim-Metyl	8

Thấy rằng các hợp chất có công thức I có số lần va chạm về không gian Van-der-Waals nhỏ và cũng có hoạt tính cao không ngờ chống lại các chủng nấm có khả năng chịu được chất ức chế Qo chứa đột biến G143A nêu trên trong các thí nghiệm vi chuẩn cũng như trong các thí nghiệm trên cánh đồng tại các vị trí mà có phần lớn các chủng nấm có khả năng chịu được chất ức chế Qo chứa đột biến G143A nêu trên (xem dưới đây).

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Phương pháp diệt nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, trong đó đột biến này là G143A, bao gồm:

xử lý nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, trong đó đột biến là G143A, hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống mà có nguy cơ bị bệnh từ nấm gây bệnh trên cây chứa đột biến trong gen sắc tố tế bào ty lạp thể b gây tính kháng chất ức chế Qo, trong đó đột biến là G143A, một lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức I



trong đó:

R^1, R^2 độc lập với nhau là hydro, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyloxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkyl}$ hoặc $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkyl-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, trong đó các nhóm R^1 và R^2 được định hướng cis, hoặc

R^1 và R^2 cùng với hai nguyên tử cacbon liên kết với chúng để tạo thành vòng phenyl miễn là R^4 là 4-metyl-1,4-dihydro-tetrazol-5-on-1-yl (công thức R4-7), và

trong đó các phân tử béo của R^1 và/hoặc R^2 hoặc vòng phenyl nêu trên có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^a giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^a halogen, CN, nitro, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-haloalkyl}$ và $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-haloalkoxy}$;

Y là liên kết trực tiếp hoặc nhóm có hóa trị hai được chọn từ $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{CHZ}-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ và $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$,

trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của nhóm có hóa trị hai Y được gắn với R^3 , và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thế bởi R^2 , và Z, mà có thể giống hoặc khác với Z bất kỳ khác, là hydro, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$ hoặc $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-haloalkyl}$;

R^3 là phenyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heteroxyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S;

trong đó the các nhóm vòng R^3 có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^b , mà có thể giống hoặc khác với R^b bất kỳ khác, là amino, halogen, hydroxyl, oxo, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkyl-carbonyloxy, phenyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó các nhóm phenyl và heteroxyclyl R^b nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh, và

hai gốc R^b mà được liên kết với các nguyên tử cạnh vòng liền kề của nhóm vòng R^3 có thể tạo thành cùng với các nguyên tử cạnh vòng nêu trên một vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5, 6 hoặc 7 cạnh vòng nóng chảy, mà có thể là vòng cacbon hoặc vòng khác loại, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của vòng khác loại bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S,

và

trong đó các nhóm béo hoặc nhóm vòng R^b có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^c giống nhau hoặc khác nhau:

R^c , mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxyimino-, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino-, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino-, C_2 - C_6 -haloalkenyloxyimino-, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, phenyl hoặc heteroxyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng

mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; trong đó các nhóm vòng R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh, và trong đó các nhóm béo hoặc nhóm vòng R^c có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^d giống nhau hoặc khác nhau:

R^d , mà có thể giống hoặc khác với R^d bất kỳ khác, là halogen, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

hoặc

R^3 là $-CR^A=N-O-R^B$, trong đó

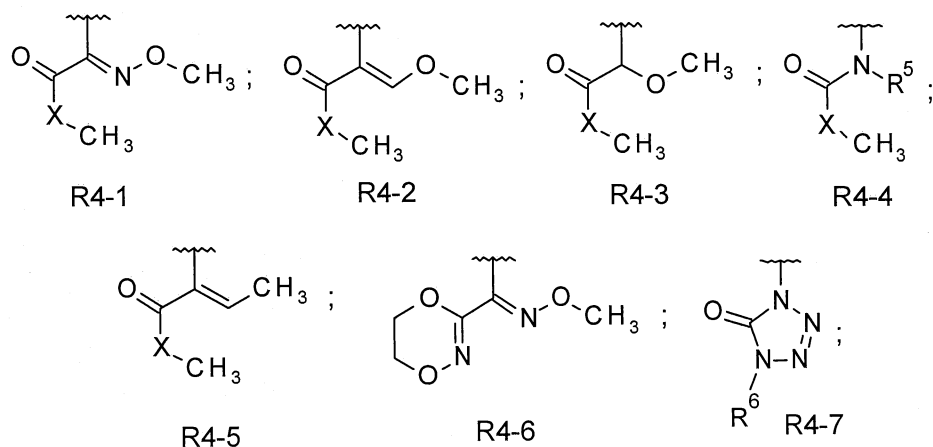
R^A là amino, hydroxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyl-oxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylamino, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, C₁-C₄-alkylcarbonyloxy, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và trong đó R^A vòng nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh;

R^B là C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphtyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng;

trong đó các nhóm béo hoặc nhóm thơm R^A và/hoặc R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau:

R^e , mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy hoặc C₁-C₄-haloalkoxy;

R^4 là nhóm có hóa trị một được chọn từ các công thức từ R4-1 đến R4-7



trong đó đường răng cưa xác định điểm liên kết, và

X là liên kết trực tiếp hoặc nhóm có hóa trị hai CH₂, O hoặc NH,

R⁵ là C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-haloalkoxy hoặc C₃-C₆-xycloalkyl,

R⁶ là C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

và các N-oxit và các muối được chấp nhận trong nông nghiệp của chúng, hoặc một chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức I.

2. Phương pháp theo điểm 1, trong đó nấm gây bệnh trên cây được chọn từ nhóm bao gồm *Alternaria alternata*, *Blumeria graminis*, *Pyricularia oryzae* (cũng được biết đến là *Magnaporthe grisea*), *Septoria tritici* (cũng được biết đến là *Mycosphaerella graminicola*), *Mycosphaerella fijiensis*, *Venturia inaequalis*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis* và *Plasmopara viticola*.

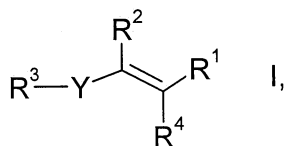
3. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 2, trong đó nấm gây bệnh trên cây là *Septoria tritici*.

4. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, bao gồm:

a) xác định nấm gây bệnh trên cây như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống mà có nguy cơ bị bệnh từ nấm gây bệnh trên cây như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, và

b) xử lý nấm hoặc vật liệu, thực vật, đất trồng hoặc hạt giống nêu trên với một lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức I như được xác định theo điểm 1, hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

5. Hợp chất có công thức I



trong đó:

R^1, R^2 độc lập với nhau là hydro, halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl hoặc C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, trong đó các nhóm R^1 và R^2 được định hướng cis,

trong đó các phân tử béo của R^1 và/hoặc R^2 có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^a giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^a halogen, CN, nitro, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkyl và C_1 - C_4 -haloalkoxy;

Y là liên kết trực tiếp hoặc nhóm có hóa trị hai được chọn từ $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{CHZ}-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ và $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$,

trong đó liên kết được mô tả trên mặt trái của nhóm có hóa trị hai Y được gắn với R^3 , và liên kết được mô tả trên mặt phải được gắn với nguyên tử cacbon được thế bởi R^2 , và Z, mà có thể giống hoặc khác với Z bất kỳ khác, là C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl;

R^3 là phenyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng trong đó các nguyên tử cạnh vòng của heteroxyclyl bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S;

trong đó các nhóm vòng R^3 có thể mang 1, 2, 3, 4 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^b giống nhau hoặc khác nhau mà độc lập với nhau được chọn từ:

R^b , mà có thể giống hoặc khác với R^b bất kỳ khác, là amino, halogen, hydroxyl, oxo, nitro, CN, carboxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkenyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -alkynyloxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylamino, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyloxy, phenyl, naphthyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa,

không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó các nhóm phenyl và heteroxyclyl R^b nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh;

và

hai gốc R^b mà được liên kết với các nguyên tử cạnh vòng liền kề của nhóm vòng R^3 có thể tạo thành cùng với các nguyên tử cạnh vòng nêu trên một vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5, 6 hoặc 7 cạnh vòng nóng chảy, mà có thể là vòng cacbon hoặc vòng khác loại, trong đó các nguyên tử cạnh vòng của vòng khác loại nóng chảy bao gồm, ngoài các nguyên tử cacbon, 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm N, O và S, và

trong đó các nhóm béo hoặc nhóm vòng R^b có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^c giống nhau hoặc khác nhau:

R^c , mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-alkenyloxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-alkynyloxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxyimino-, C₂-C₆-alkenyloxyimino-, C₂-C₆-alkynyloxyimino-, C₂-C₆-haloalkenyloxyimino-, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, phenyl hoặc heteroxyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; trong đó các nhóm vòng R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh và trong đó các nhóm béo hoặc nhóm vòng R^c có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^d giống nhau hoặc khác nhau:

R^d , mà có thể giống hoặc khác với R^d bất kỳ khác, là halogen, C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

hoặc

R^3 là $-CR^A=N-O-R^B$, trong đó

R^A là amino, hydroxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, C₂-C₆-alkenyl-oxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylamino, C₁-C₄-

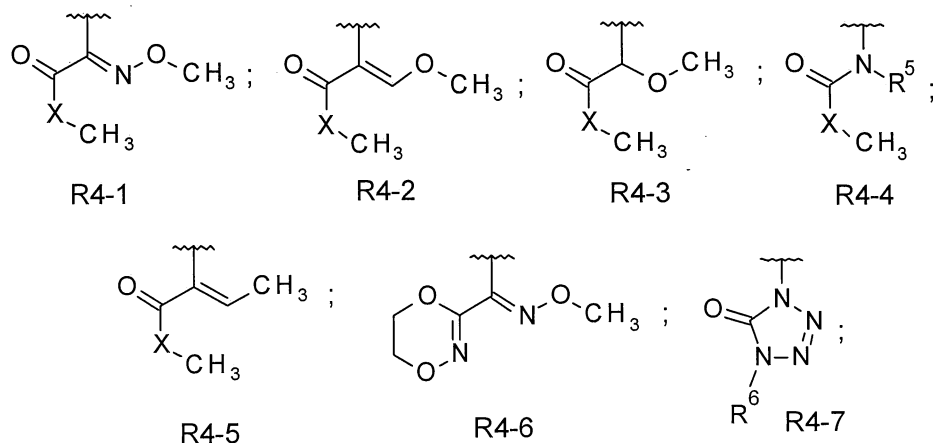
alkoxycarbonyl, C₁-C₄-alkylcarbonyloxy, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphthyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng; và trong đó R^A vòng nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh;

R^B là C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkenyl, CC₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, phenyl, phenyl-C₁-C₄-alkyl, naphthyl hoặc heteroxyclyl đơn vòng hoặc hai vòng bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có từ 3 đến 10 cạnh vòng hoặc mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến bốn nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm O, N và S là các cạnh vòng;

trong đó các nhóm béo hoặc nhóm vòng R^A và/hoặc R^B có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^e giống nhau hoặc khác nhau:

R^e, mà có thể giống hoặc khác với R^e bất kỳ khác, là halogen, hydroxyl, nitro, CN, carboxyl, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy hoặc C₁-C₄-haloalkoxy;

R⁴ là nhóm có hóa trị một được chọn từ các công thức R4-1 đến R4-7



trong đó đường răng cưa xác định điểm liên kết, và trong đó

X là nhóm có hóa trị hai O hoặc NH,

R⁵ là C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-haloalkoxy hoặc C₃-C₆-xycloalkyl,

R⁶ là C₁-C₄-alkyl hoặc C₁-C₄-haloalkyl;

và các N-oxit và các muối được chấp nhận trong nông nghiệp của chúng, ngoại trừ metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(4-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic (207852-99-1), metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-5-(3-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic (207853-00-7); metyl este của axit (E)-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-4-metyl-5-(3-phenoxy-phenoxy)-3-triflometyl-pent-3-enoic, metyl este của axit (E)-5,5,5-triflo-2-[1-metoxymeth-(E)-yliden]-3-metyl-4-(4-phenoxy-phenoxy-metyl)-pent-3-enoic, và metyl este của axit (2E,3Z)-2-(etyliden)-5-phenyl-3-pentenoic (CAS-No. 681026-20-0).

6. Hợp chất theo điểm 5, với điều kiện là R^1 không là CF_3 nếu R^4 là 1-metoxycarbonyl-2-metoxymethen-1-yl (công thức R4-2, trong đó X là O).

7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 6, trong đó R^1 là hydro, halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -cloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl.

8. Hợp chất theo điểm 7, trong đó R^1 là metyl hoặc etyl.

9. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 6, trong đó R^2 là hydro.

10. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 9, trong đó Y là $-OCH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-C(CH_3)=N-O-CH_2-$, $-O-N=C(CH_3)-C(CH_3)=N-O-CH_2-$ hoặc $-C(=N-O-CH_3)-C(CH_3)=N-O-CH_2-$.

11. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 10, trong đó R^3 là pyrazolyl, imidazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, 1,2,4-triazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl or 1,2,4-thiadiazolyl, mà được thế bởi phenyl, trong đó phenyl nêu trên có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^c giống nhau hoặc khác nhau:

R^c , mà có thể giống hoặc khác với R^c bất kỳ khác, là halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, phenyl hoặc heterocyclyl bão hòa, không bão hòa một phần hoặc thơm có 5 cạnh vòng mà, ngoài các nguyên tử cacbon, chứa từ một đến ba nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O và S là các cạnh vòng; và trong đó các nhóm heterocyclyl R^c nêu trên được gắn qua liên kết trực tiếp, nguyên tử oxy hoặc lưu huỳnh và có thể mang 1, 2, 3 hoặc lên đến con số tối đa các nhóm R^d giống nhau hoặc khác nhau.

12. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 10, trong đó R^4 là $-C(=NOCH_3)-CONHCH_3$, $-C(=NOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-CONHCH_3$, $-N(OCH_3)-COOCH_3$, $-N(CH_3)-COOCH_3$ hoặc $-N(CH_2CH_3)-COOCH_3$.

13. Chế phẩm hóa nông trong đó chế phẩm này bao gồm chất phụ trợ và ít nhất một hợp chất có công thức I, như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 5 đến 12, N-oxit hoặc muối được chấp nhận trong nông nghiệp của hợp chất này.

14. Chế phẩm theo điểm 13 bao gồm thêm ít nhất một hoạt chất.

15. Chế phẩm theo điểm 14, trong đó hoạt chất nêu trên được chọn từ các nhóm từ A) đến O):

A) Chất ức chế hô hấp

- Chất ức chế của phức hệ III tại vị trí Q_0 (ví dụ, strobilurin): azoxystrobin, coumetoxystrobin, coumoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fenaminstrobin, fenoxystrobin/flufenoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, trifloxystrobin, este metyl của axit 2-[2-(2,5-dimetyl-phenoxy-metyl)-phenyl]-3-metoxycrylic và 2-(2-(3-(2,6-diclophenyl)-1-metyl-allylideneaminooxymetyl)-phenyl)-2-metoxylimino-N-metyl-axetamit, pyribencarb, triclopyricarb/clodincarb, famoxadon, fenamidon;

- chất ức chế của phức hệ III tại vị trí Q_i : xyazofamit, amisulbrom, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-axetoxi-4-metoxi-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(axetoxymetoxi)-4-metoxi-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-isobutoxycarbonyloxy-4-metoxi-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ylmetoxi)-4-metoxi-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat; (3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hydroxy-4-metoxi-2-pyridinyl)carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-8-(phenylmetyl)-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat;

- chất ức chế của phức hệ II (ví dụ, carboxamit): benodanil, bixafen, boscalit, carboxin, fenfuram, fluopyram, flutolanil, fluxapyroxat, furametypr, isopyrazam, mepronil, oxycarboxin, penflufen, penthiopyrat, sedaxan, tecloftalam, thifluzamit, N-(4'-triflometylthiobiphenyl-2-yl)-3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, N-(2-(1,3,3-trimetyl-butyl)-phenyl)-1,3-dimetyl-5-flo-1H-pyrazol-4-carboxamit, N-[9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(triflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(triflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 3-(diflo-metyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit, 1,3,5-tri-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit;
- các chất ức chế hô hấp khác (ví dụ, phức chất I, chất không cặp đôi): diflumentorim, (5,8-difloquinazolin-4-yl)-{2-[2-flo-4-(4-triflometylpyridin-2-yloxy)-phenyl]-etyl}-amin; các dẫn xuất của nitrophenyl: binapacryl, dinobuton, dinocap, fluazinam; ferimzon; các hợp chất hữu cơ kim loại: muối fentin, như fentin-axetat, fentin clorua hoặc fentin hydroxit; ametotradin; và silthiofam;

B) Chất ức chế tổng hợp sinh học sterol (các thuốc diệt nấm SBI)

- Chất ức chế demetylaza C14 (các thuốc diệt nấm DMI): triazol: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, xyproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, oxpoconazol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, -[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol; imidazol: imazalil, pefurazoat, procloraz, triflumizol; pyrimidin, pyridin và piperazin: fenarimol, nuarimol, pyrifenox, triforin;
- Chất ức chế delta14-reductaza: aldimorph, dodemorph, dodemorph-axetat, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, piperalin, spiroxamin;
- Chất ức chế của 3-keto reductaza: fenhexamit;

C) Chất ức chế tổng hợp của axit nucleic

- phenylamit hoặc các thuốc diệt nấm của axit amin axyl: benalaxyl, benalaxyl-M, kiralaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M (mefenoxam), ofurace, oxadixyl;
- các chất ức chế khác: hymexazol, othilionon, axit oxolinic, bupirimat, 5-floxytosin, 5-flo-2-(p-tolylmetoxy)pyrimidin-4-amin, 5-flo-2-(4-flophenylmetoxy)pyrimidin-4-amin;

D) Chất ức chế phân chia tế bào và xytoskeleton

- chất ức chế tubulin, như benzimidazol, thiophanat: benomyl, carbendazim, fuberidazol, thiabendazol, thiophanat-metyl; triazolopyrimidin: 5-clo-7-(4-metyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin
- các chất ức chế phân chia tế bào khác: dietofencarb, etaboxam, penxycuron, fluopicolit, zoxamit, metrafenon, pyriofenon;

E) Chất ức chế của axit amin và tổng hợp protein

- chất ức chế tổng hợp methionin (anilino-pyrimidin): xyprodinil, mepanipirim, pyrimethanil;
- chất ức chế tổng hợp protein: blastixidin-S, kasugamycin, kasugamycin hydroclorua-hydrat, mildiomyxin, streptomycin, oxytetracyclin, polyoxin, validamycin A;

F) Chất ức chế tải nạp tín hiệu

- MAP / chất ức chế histidin kinaza: floimit, iprodion, proxymidon, vinclozolin, fenpiclonil, fludioxonil;
- chất ức chế protein G: quinoxifen;

G) Chất ức chế tổng hợp lipid và màng

- Chất ức chế tổng hợp phospholipit: edifenphos, iprobenfos, pyrazophos, isoprothiolan;
- Peroxy hóa lipid: dicloran, quintozen, tecnazen, tolclofos-metyl, biphenyl, cloneb, etridiazol;
- tổng hợp sinh học phospholipit và kết tủa thành tế bào: dimetomorph, flumorph, mandipropamit, pyrimorph, benthiavalicarb, iprovalicarb, valifenalat và este của axit N-(1-(1-(4-xyano-phenyl)etansulfonyl)-but-2-yl) carbamic-(4-flophenyl);
- các hợp chất ảnh hưởng đến độ thấm màng tế bào và các axit béo: propamocarb, propamocarb-hydroclorit;

- các chất ức chế hydrolaza amit của axit béo: 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon;

H) Các chất ức chế có tác dụng ở nhiều vị trí

- các hoạt chất vô cơ: hỗn hợp Bordeaux, đồng axetat, đồng hydroxit, đồng oxyclorea, đồng bazơ sulfat, lưu huỳnh;
- thio- và dithiocarbamat: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram;
- các hợp chất clo hữu cơ (ví dụ, phtalimit, sulfamit, clonitrit): anilazin, clothalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanit, diclophen, flusulfamit, hexaclobenzen, pentaclophenol và các muối của nó, phtalit, tolylfluanit, N-(4-clo-2-nitro-phenyl)-N-etyl-4-metyl-benzensulfonamit;
- guanidin và các hợp chất khác: guanidin, dodin, bazơ không chứa dodin, guazatin, guazatin-axetat, iminocadin, iminocadin-triaxetat, iminocadin-tris(albesilat), dithianon, 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraon;

I) Các chất ức chế tổng hợp thành tế bào

- các chất ức chế tổng hợp glucan: validamycin, polyoxin B; các chất ức chế tổng hợp melanin: pyroquilon, trixylazol, carpropamit, dixyclomet, fenoxanil;

J) Tác nhân gây cảm ứng bảo vệ cây

- axibenzolar-S-metyl, probenazol, isotianil, tiadinil, prohexadion-canxi; phosphonat: fosetyl, fosetyl-nhôm, axit phosphor và các muối của nó;

K) Tác dụng chưa biết

- bronopol, chinomethionat, xyflufenamit, xymoxanil, dazomet, debacarb, diclo-mezin, difenzoquat, difenzoquat-metylsulfat, diphenylamin, fenpyrazamin, flumetover, flusulfamit, flutianil, methasulfocarb, nitrapyrin, nitrothal-isopropyl, oxin-đồng, proquinazit, tebufloquin, tecloftalam, triazoxit, 2-butoxy-6-iodo-3-propylchromen-4-on, N-(xyclopropylmetoxyimino-(6-diflo-metoxi-2,3-diflo-phenyl)-metyl)-2-phenyl axetamit, N'-(4-(4-clo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(4-(4-flo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(2-metyl-5-triflometyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(5-diflometyl-2-metyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-

etyl-N-metyl formamidin, axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-carboxylic metyl-(1,2,3,4-tetrahydro-naphtalen-1-yl)-amit, axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-carboxylic metyl-(R)-1,2,3,4-tetrahydro-naphtalen-1-yl-amit, 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, este của axit metoxy-axetic 6-tert-butyl-8-flo-2,3-dimetyl-quinolin-4-yl, N-Metyl-2-{1-[(5-metyl-3-triflometyl-1H-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphtalen-1-yl]-4-thiazolcarboxamit, 3-[5-(4-metylphenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin, 3-[5-(4-clo-phenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin (pyrisoxazol), amit của axit N-(6-metoxi-pyridin-3-yl) xyclopropanocarboxylic, 5-clo-1-(4,6-dimetoxi-pyrimidin-2-yl)-2-metyl-1H-benzoimidazol, 2-(4-clo-phenyl)-N-[4-(3,4-dimetoxi-phenyl)-isoxazol-5-yl]-2-prop-2-ynyloxy-axetamit;

L) Các chất kiểm soát sinh học có tác dụng chống nấm, các chất hoạt hóa sinh học ở cây:

Ampelomyces quisqualis, Aspergillus flavus, Aureobasidium pullulans, Bacillus pumilus, Bacillus subtilis, Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens FZB24, Candida oleophila I-82, Candida saitoana, Chitosan, Clonostachys rosea f. catenulata, cũng được gọi là Gliocladium catenulatum, Coniothyrium minitans, Cryphonectria parasitica, Cryptococcus albidus, Fusarium oxysporum, Metschnikowia fructicola, Microdochium dimerum, Phlebiopsis gigantea, Pseudozyma flocculosa, Pythium oligandrum DV74, Reynoutria sachlinensis, Talaromyces flavus V117b, Trichoderma asperellum SKT-1, T. atroviride LC52, T. harzianum T-22, T. harzianum TH 35, T. harzianum T-39, T. harzianum và T. viride, T. harzianum ICC012 và T. viride ICC080, T. polysporum và T. harzianum, T. stromaticum, T. virens GL-21, T. viride, T. viride TV1, Ulocladium oudemansii HRU3;

M) Các chất điều chỉnh tăng trưởng

axit absxiscic, amidoclo, anxymidol, 6-benzylaminopurin, brassinolit, butralin, clomequat (clomequat clorua), colin clorua, xyclanilit, daminozit, dikegulac, dimethipin, 2,6-dimetylpuridin, etephon, flumetralin, flurprimidol, fluthiaxet, forclofenuron, axit giberelic, inabenfit, axit indol-3-axetic, hydrazit maleic, mefluidit, mepiquat (mepiquat

clorua), axit naphtalenaxetic, N-6-benzyladenin, paclobutrazol, prohexadion (prohexadion-canxi), prohydrojasmon, thidiazuron, triapenthenol, tributyl phosphotriethioat, axit 2,3,5-tri-iodobenzoic, trinexapac-etyl và uniconazol;

N) Thuốc diệt cỏ

- acetamit: acetoclo, alaclo, butaclo, dimetaclo, dimetenamit, flufenaxet, mefenaxet, metolaclo, metazaclo, napropamit, naproanilit, pethoxamit, pretilaclo, propaclo, thenylclo;
- các dẫn xuất của axit amin: bilanafos, glyphosat, glufosinat, sulfosat;
- aryloxyphenoxypropionat: clodinafop, xyhalofop-butyl, fenoxaprop, fluazifop, haloxyfop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P-tefuryl;
- Bipyridyl: diquat, paraquat;
- (thio)carbamat: asulam, butylat, carbetamit, desmedipham, dimepiperat, eptam (EPTC), esprocarb, molinat, orbencarb, phenmedipham, prosulfocarb, pyributicarb, thiobencarb, trialat;
- xyclohexandion: butroxydim, clethodim, xycloxydim, profoxydim, setoxydim, tepraloxym, tralkoxydim;
- dinitroanilin: benfluralin, ethalfluralin, oryzalin, pendimethalin, prodiamin, trifluralin;
- ete diphenyl: axiflofen, aclonifen, bifenox, diclofop, etoxyfen, fomesafen, lactofen, oxyflofen;
- hydroxybenzonitril: bomoxynil, diclobenil, ioxynil;
- imidazolinon: imazamethabenz, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazethapyr;
- axit axetic phenoxy: clomeprop, axit 2,4-diclophenoxyaxetic (2,4-D), 2,4-DB, dicloprop, MCPA, MCPA-thioetyl, MCPB, Mecoprop;
- pyrazin: clodazon, flufenpyr-etyl, fluthiaxet, norflurazon, pyridat;
- pyridin: aminopyralit, clopyralit, diflufenican, dithiopyr, fluridon, fluroxypyr, picloram, picolinafen, thiazopyr;
- sulfonyl urê: amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, cloimuron-etyl, closulfuron, xinosulfuron, xyclosulfamuron, etoxysulfuron, flazasulfuron, fluxetosulfuron, flupyr-sulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron,

iodosulfuron, mesosulfuron, metazosulfuron, metsulfuron-metyl, nicosulfuron, oxasulfuron, primisulfuron, prosulfuron, pyrazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron, thifensulfuron, triasulfuron, tribenuron, trifloxysulfuron, triflusulfuron, tritosulfuron, 1-((2-clo-6-propyl-imidazo[1,2-b]pyridazin-3-yl)sulfonyl)-3-(4,6-

dimetoxi-pyrimidin-2-yl)urê;

- triazin: ametryn, atrazin, xyanazin, dimethametryn, ethiozin, hexazinon, metamitron, metribuzin, prometryn, simazin, terbuthylazin, terbutryn, triaziflam;

- urê: clotoluron, daimuron, diuron, flometuron, isoproturon, linuron, metha-benzthiazuron, tebuthiuron;

- các chất ức chế axetolactat synthaza khác: bispyribac-natri, cloransulam-metyl, diclosulam, florasulam, flucarbazon, flumetsulam, metosulam, ortho-sulfamuron, penoxsulam, propoxycarbazon, pyribambenz-propyl, pyribenzoxim, pyrifitalit, pyriminobac-metyl, pyrimisulfan, pyriothiobac, pyroxasulfon, pyroxsulam;

- các hợp chất khác: amicarbazon, aminotriazol, anilofos, beflubutamid, benazolin, bencarbazon, benfluresat, benzofenap, bentazon, benzobixyclon, bixyclopyron, bromaxil, bromobutit, butafenaxil, butamifos, cafenstrol, carfentrazon, xinidon-etyl, clothal, xinmetylin, clomazon, xumyluron, xyprosulfamid, dicamba, difenzoquat, diflufenzopyr, Drechslera monoceras, endothal, etofumesat, etobenzanit, fenoxasulfon, fentrazamid, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, flupoxam, floclidon, flurtamon, indanofan, isoxaben, isoxaflutol, lenaxil, propanil, propyzamid, quinclozac, quinmerac, mesotrion, metyl axit arsonic, naptalam, oxadiargyl, oxadiazon, oxaziclomefon, pentoxazon, pinoxaden, pyraclozil, pyraflufen-etyl, pyrasulfotol, pyrazoxyfen, pyrazolynat, quinoclamid, saflufenaxil, sulcotrion, sulfentrazon, terbaxil, tefuryltrion, tembotrion, thiencarbazon, topramezon, este etyl của axit (3-[2-clo-4-flo-5-(3-metyl-2,6-dioxo-4-triflometyl-3,6-dihydro-2H-pyrimidin-1-yl)-phenoxy]-pyridin-2-yloxy)-acetic, este metyl của axit 6-amino-5-clo-2-xyclopropyl-pyrimidin-4-carboxylic, axit 6-clo-3-(2-xyclopropyl-6-metyl-phenoxy)-pyridazin-4-ol, 4-amino-3-clo-6-(4-clo-phenyl)-5-flo-pyridin-2-carboxylic, este metyl của axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxi-phenyl)-pyridin-2-carboxylic, và este metyl của axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-3-dimetylamin-2-flo-phenyl)-pyridin-2-carboxylic.

O) Thuốc trừ sâu

- (thio)phosphat hữu cơ: axephat, azamethiphos, azinphos-metyl, clopyrifos, clopyrifos-metyl, clofenvinphos, diazinon, diclofos, dicrotophos, dimetoat, disulfoton, ethion, fenitrothion, fenthion, isoxathion, malathion, methamidophos, methidathion, metyl-parathion, mevinphos, monocrotophos, oxydemeton-metyl, paraoxon, parathion, phentoat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phorat, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, prothiofos, sulprophos, tetraclovinphos, terbufos, triazophos, triclofon;
- carbamat: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, fenoxycarb, furathiocarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamat;
- pyrethroit: alethrin, bifenthrin, xyfluthrin, xyhalothrin, xyphenothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, beta-xypermethrin, zeta-xypermethrin, deltamethrin, esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, imiprothrin, lambda-xyhalothrin, permethrin, pralethrin, pyrethrin I và II, resmethrin, silafluofen, tau-fluvalinat, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, profluthrin, dimefluthrin;
- chất điều chỉnh sự tăng trưởng của côn trùng: a) chất ức chế tổng hợp kitin: benzoylurê: cloflazuron, xyramazin, diflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazol, clofentazin; b) chất đối kháng ecdyson: halofenozit, metoxyfenozit, tebufenozit, azadirachtin; c) juvenoit: pyriproxyfen, methopren, fenoxycarb; d) chất ức chế tổng hợp sinh học lipid: spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat;
- các hợp chất cơ chủ vận/đối kháng thụ thể nicotin: clothianidin, dinotefuran, flupyradifuron, imidacloprit, thiamethoxam, nitenpyram, axetamiprit, thiacloprit, 1-2-clothiazol-5-ylmetyl)-2-nitrimino-3,5-dimetyl-[1,3,5]triazinan;
- các hợp chất đối kháng GABA: endosulfan, ethiprol, fipronil, vaniliprol, pyrafluprol, pyriprol, amit của axit 5-amino-1-(2,6-diclo-4-metyl-phenyl)-4-sulfinamoyl-1H-pyrazol-3-carbothioic;
- thuốc trừ sâu lacton macrocyclic: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad, spinetoram;
- thuốc diệt ve bét chứa chất ức chế vận chuyển electron mitochondrial I (METI): fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenimer;

- các hợp chất METI II và III: axequinoxyl, fluaxyprim, hydrametylnon;
- hợp chất không cặp đôi: clofenapyr;
- chất ức chế phosphoryl hóa oxy hóa: xyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxit, propargit;
- các hợp chất phá vỡ sự rụng lông: cryomazin;
- các chất ức chế oxidaza chức năng hỗn hợp: piperonyl butoxit;
- khối có rãnh natri: indoxacarb, metaflumizon;
- các hợp chất khác: benclothiaz, bifenazat, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozin, lưu huỳnh, thioxyclam, flubendiamit, cloantraniliprol, xyazypyr (HGW86), xyenopyrafen, flupyrazofos, xyflumetofen, amidoflumet, imixyafos, bistrifluron, và pyrifluquinazon.

Fig. 1

Mô hình cấu trúc của vị trí liên kết đột biến G143A

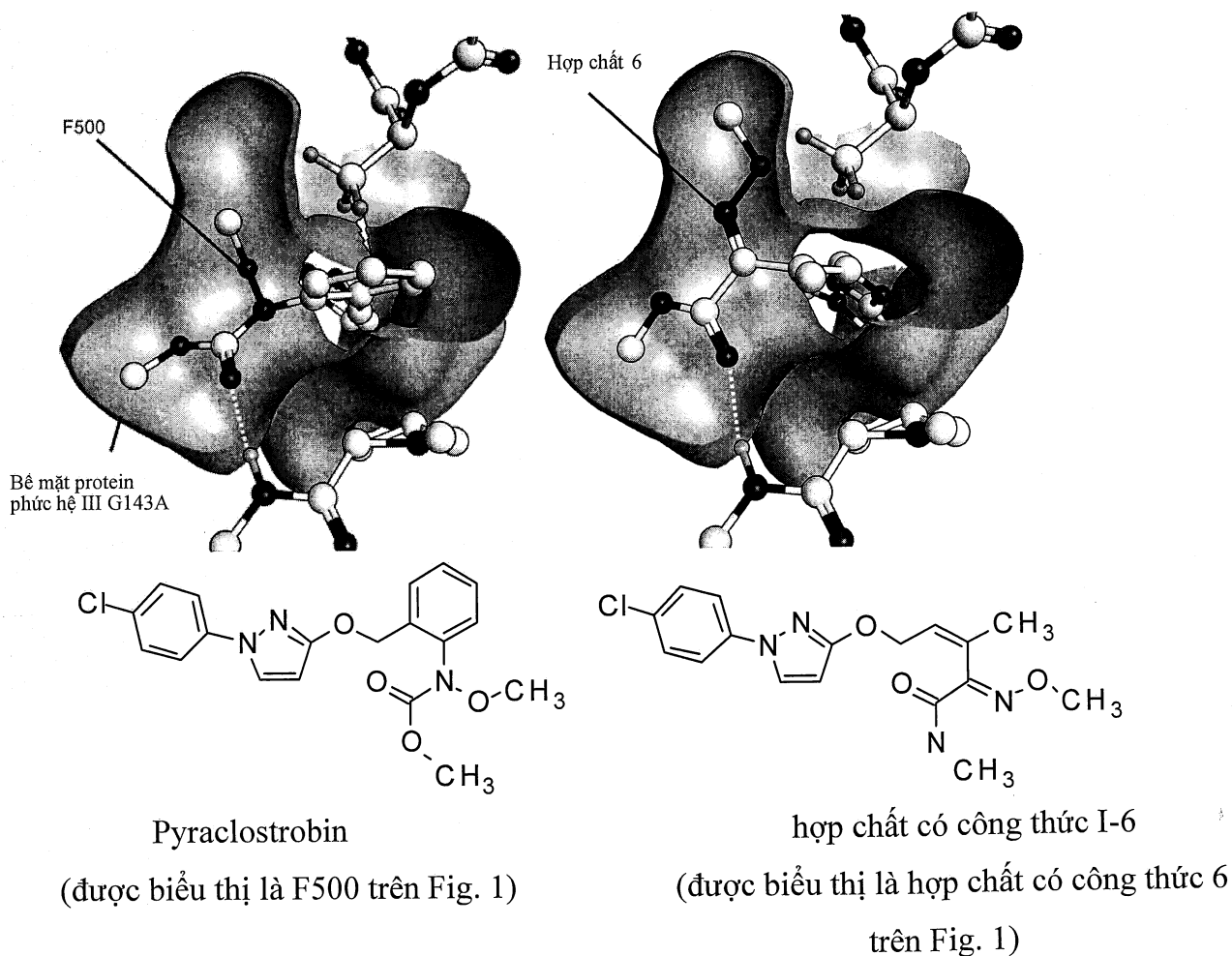


Fig. 1: Hợp chất Pyraclostrobin tương tự strobilurin bán sẵn trên thị trường được mô hình thành vị trí liên kết Qo của phức hệ sắc tố tế bào bc₁ nhân tạo thể hiện sự va chạm về không gian của vòng phenyl với nhóm methyl 143A như được biểu thị bởi mũi tên ở phần bên phải phía trên của Fig. 1 (bên trái). Hợp chất có công thức I-6 theo sáng chế không thể hiện sự va chạm về không gian (bên phải).