



(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)

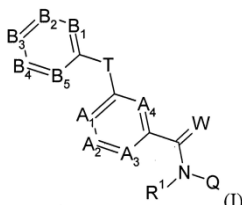


1-0027493

(51)⁷ C07D 249/06; A61K 31/4192; A61K 31/4439; C07D 409/12; C07D 401/04; A01N 43/647; A61P 33/00 (13) B

- (21) 1-2016-01891 (22) 05/11/2014
(86) PCT/EP2014/073796 05/11/2014 (87) WO2015/067648 14/05/2015
(30) 13191612.4 05/11/2013 EP
(45) 25/02/2021 395 (43) 25/08/2016 341A
(73) BAYER ANIMAL HEALTH GMBH (DE)
Kaiser-Wilhelm-Allee 10, 51373 Leverkusen, Germany
(72) HALLENBACH, Werner (DE); GÖRGENS, Ulrich (DE); TURBERG, Andreas (DE); ILG, Kerstin (DE); HORSTMANN, Sebastian (DE); KÖBBERLING, Johannes (DE).
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

- (54) HỢP CHẤT ĐƯỢC THỂ HALOGEN, CHẾ PHẨM DIỆT CÔN TRÙNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP BẢO VỆ HẠT CHUYỂN GEN HOẶC HẠT THÔNG THƯỜNG VÀ THỰC VẬT MỌC LÊN TỪ CHÚNG
(57) Sáng chế, đề cập đến hợp chất có công thức chung (I):



trong đó, mỗi một gốc A₁-A₄, T, W, Q, R¹ và B₁-B₄ như được xác định trong phần mô tả. Sáng chế cũng đề cập đến các quy trình điều chế hợp chất có công thức (I). Hợp chất theo sáng chế là đặc biệt thích hợp để kiểm soát côn trùng, nhện và giun tròn trong nông nghiệp, và ngoại ký sinh trùng trong thuốc thú y.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các hợp chất được thế halogen và quy trình điều chế chúng. Các hợp chất này là hữu hiệu để phòng trừ động vật gây hại, cụ thể là động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng, nhện và giun tròn.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Đã biết rằng, các hợp chất được thế halogen cụ thể có hoạt tính diệt côn trùng (các tài liệu EP 1 911 751, WO2012/069366, WO2012/080376, WO2012/107434 và WO2012/175474).

Tài liệu WO 2011/113756 bộc lộ các dẫn xuất triazol có hoạt tính diệt côn trùng.

Cũng đã biết rằng, các hợp chất được thế halogen cụ thể có hoạt tính ức chế xytokin (WO 2000/07980).

Các chế phẩm bảo vệ cây trồng mới cần phải đáp ứng nhiều yêu cầu, ví dụ các yêu cầu về hiệu quả, độ tồn lưu, phổ tác động và việc sử dụng có thể. Các vấn đề về độc tính và khả năng kết hợp với thành phần hoạt tính khác hoặc các chất phụ gia phối chế đóng vai trò nhất định, vì cần phải có chi phí trong quá trình tổng hợp một thành phần hoạt tính. Ngoài ra, tính kháng có thể xuất hiện. Vì tất cả những lý do này, vấn đề tìm kiếm chế phẩm bảo vệ cây trồng mới có thể không bao giờ được coi là hoàn thành và vẫn luôn thường trực nhu cầu về hợp chất mới có các đặc tính được cải thiện hơn so với hợp chất đã biết, ít nhất về từng khía cạnh riêng biệt.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

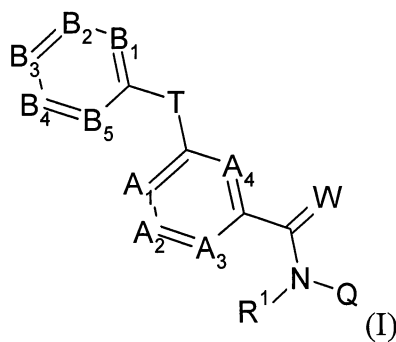
Mục đích của sáng chế là đề cập đến hợp chất mà hợp chất này mở rộng thêm phổ của chất diệt sinh vật gây hại theo các khía cạnh khác nhau và/hoặc cải thiện hơn nữa hoạt tính của chúng.

Thật bất ngờ, hiện nay đã phát hiện ra rằng, hợp chất được thế halogen cụ thể

và muối của nó có các đặc tính sinh học và đặc biệt thích hợp để phòng trừ động vật gây hại và do đó, có khả năng sử dụng đặc biệt tốt trong lĩnh vực hóa nông và trong lĩnh vực sức khỏe động vật.

Hợp chất tương tự cũng đã biết trong tài liệu WO 2010/051926.

Hợp chất có hoạt tính diệt côn trùng, trừ nhện và/hoặc diệt ký sinh trùng và có công thức chung (I) đã được phát hiện:



trong đó:

R^1 là H, trong mỗi trường hợp, là C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, aryl(C_1 - C_3)-alkyl, heteroaryl(C_1 - C_3)-alkyl được thể tùy ý,

các gốc tiếp theo là như sau:

A_1 là CR^2 hoặc N,

A_2 là CR^3 hoặc N,

A_3 là CR^4 hoặc N,

A_4 là CR^5 hoặc N,

B_1 là CR^6 hoặc N,

B_2 là CR^7 hoặc N,

B_3 là CR^8 hoặc N,

B_4 là CR^9 hoặc N, và

B_5 là CR^{10} hoặc N,

nhưng không quá ba trong số các gốc từ A₁ đến A₄ là N và không quá ba trong số các gốc từ B₁ đến B₅ là N;

mỗi gốc R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹ và R¹⁰ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₆-alkylamino được thể tùy ý;

nếu như không gốc nào trong số các gốc A₂ và A₃ là N, thì R³ và R⁴ cùng với nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng có 5 hoặc 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử oxy và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử lưu huỳnh, hoặc

nếu không có gốc nào trong số các gốc A₁ và A₂ là N, thì R² và R³ cùng với nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ;

R⁸ là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₆-alkylamino được thể tùy ý;

W là O hoặc S;

Q là H, formyl, hydroxyl, amino hoặc trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₅-heteroxycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₆-alkyl-C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-aryl, C₁-C₅-heteroaryl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-aryl-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₅-heteroaryl-C₁-C₃-alkyl, *N*-C₁-C₄-alkylamino, *N*-C₁-C₄-alkylcarbonylamino, hoặc *N,N*-di-C₁-C₄-alkylamino được thể tùy ý; hoặc

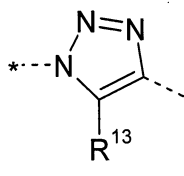
là vòng cacbon 6 cạnh không no tùy ý được thể poly-V; hoặc

là vòng dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh không no tùy ý được thể poly-V, trong đó

V độc lập là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkenyl, C₁-C₄-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-

C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, hoặc N,N-di-(C₁-C₆-alkyl)amino được thể tùy ý;

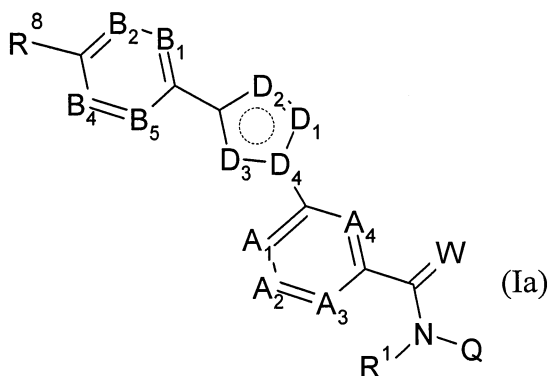
T trong mỗi trường hợp, là dị vòng thơm 5 cạnh được thể tùy ý chứa 3 nguyên tử khác loại, tốt hơn được chọn từ nhóm gồm N, O và S;



với điều kiện T không phải là

trong đó, R¹³ là H, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkyl được thể halogen hoặc xyano; và muối, N-oxit và các dạng hổ biến của hợp chất có công thức (I).

Một phương án theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) được mô tả bằng công thức (Ia):



trong đó:

mỗi gốc D₁, D₂ và D₃ độc lập là C-R¹¹ hoặc nguyên tử khác loại, tốt hơn là C-R¹¹ hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N, O hoặc S; và

D₄ là C hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N (tức là C hoặc N);

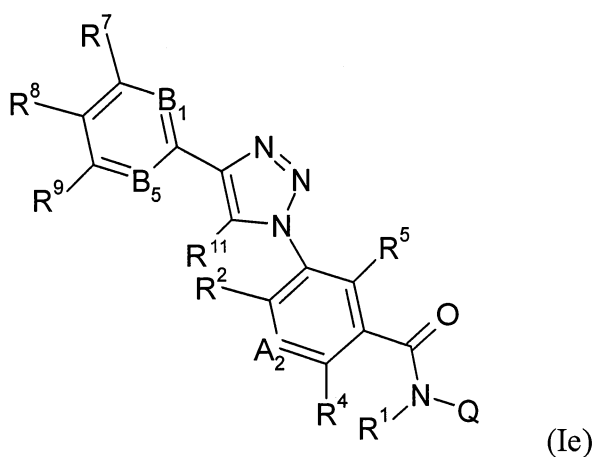
trong đó, ba gốc được chọn từ D₁, D₂, D₃ và D₄ đều là nguyên tử khác loại;

R¹¹ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, amino hoặc trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkyloxy, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl được thể tùy ý, tốt hơn là H,

là hệ thơm; và

mỗi một gốc R^1 , Q, W, A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , B_1 , B_2 , B_3 , B_4 , và B_5 như được xác định trong điểm 1, trong đó không nhiều hơn một gốc được chọn từ A_1 , A_2 , A_3 , A_4 là N và không nhiều hơn một gốc được chọn từ B_1 , B_2 , B_3 , B_4 và B_5 là N.

Phương án khác theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I), được mô tả bằng hợp chất có công thức (Ie)



trong đó, mỗi một gốc R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , Q, A_2 , B_1 và B_5 được xác định như được mô tả trong bản mô tả này.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó R^{11} độc lập là H.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó mỗi gốc R^6 , R^7 , R^9 và R^{10} độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_4 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, *N*-alkoxyiminoalkyl, C_1 - C_4 -alkylsulfanyl, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, *N*- C_1 - C_4 -alkylamino, *N,N*-di- C_1 - C_4 -alkylamino được thể tùy ý.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó mỗi gốc R^2 , R^3 , R^4 và R^5 độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_4 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, *N*- C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylsulfanyl, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, *N*- C_1 - C_4 -alkylamino hoặc *N,N*-di- C_1 - C_4 -alkylamino được thể tùy ý.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả

ở đây, trong đó các gốc từ A₁ đến A₄ và từ B₁ đến B₅ là như sau:

- A₁ là C-H,
- A₂ là CR³ hoặc N,
- A₃ là CR⁴,
- A₄ là C-H,
- B₁ là CR⁶ hoặc N,
- B₂ là C-H,
- B₃ là CR⁸,
- B₄ là C-H và
- B₅ là CR¹⁰ hoặc N.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó R¹ là H.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó Q là C₁-C₄-alkyl được thế flo, C₃-C₄-xycloalkyl, C₃-C₄-xycloalkyl tùy ý được thế xyano hoặc được thế flo, C₄-C₆-heteroxycloalkyl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, benzyl, pyridin-2-ylmetyl, metylsulphonyl hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamin)etyl.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó Q là 2,2,2-trifloetyl, 2,2-difloetyl, 3,3,3-triflopropyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopropyl, xyclobutyl, 1-xyanoxyclopropyl, trans-2-floxyclopropyl, hoặc cis-2-floxyclopropyl, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, benzyl, pyridin-2-ylmetyl, metylsulphonyl hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamin)etyl.

Phương án khác nữa theo sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức được mô tả ở đây, trong đó R⁸ là halogen hoặc C₁-C₄-alkyl được thế halogen, ví dụ metyl perflo hóa, etyl perflo hóa hoặc propyl perflo hóa. Theo một phương án, R⁸ tốt hơn là propyl perflo hóa.

Khía cạnh khác đề cập đến chế phẩm diệt côn trùng, khác biệt bởi lượng của ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây và một chất độn và/hoặc một chất hoạt động bề mặt.

Khía cạnh khác đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt chuyển gen hoặc hạt thông thường và thực vật xuất phát từ hạt nêu trên không bị nhiễm bởi sinh vật gây hại, khác biệt ở chỗ, hạt được xử lý bằng ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây.

Bản mô tả bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây hoặc chế phẩm diệt côn trùng như được mô tả ở đây để phòng trừ sinh vật gây hại.

Bản mô tả cũng bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây trong việc kiểm soát vector.

Khía cạnh khác nữa đề cập đến hạt trong đó, hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây đã được áp dụng lên hạt làm một thành phần của lớp phủ hoặc làm một lớp khác hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ.

Do đó, khía cạnh khác đề cập đến phương pháp áp dụng lớp phủ chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây hoặc phương pháp áp dụng hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây, áp dụng lên hạt dưới dạng một lớp hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ, bao gồm các bước a) trộn lẫn hạt với nguyên liệu phủ gồm hoặc chứa hợp chất có công thức (I) như được mô tả ở đây, b) làm giàu hỗn hợp hạt phủ thu được, c) sấy khô hỗn hợp hạt đã làm giàu thu được, d) tách hoặc làm rời hỗn hợp hạt sấy khô thu được.

Tùy thuộc vào bản chất của phần tử thế, hợp chất có công thức (I) mô tả ở đây tùy ý có thể ở dạng chất đồng phân dị hình và/hoặc chất đồng phân quang hoạt hoặc hỗn hợp các chất đồng phân tương ứng theo các thành phần khác nhau. Sáng chế đề cập đến cả chất đồng phân tinh khiết và hỗn hợp các chất đồng phân.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể ở dạng các phức kim loại.

Mô tả chi tiết sáng chế

Phân định nghĩa

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực nhận thức được rằng, nếu như không được thông báo một cách rõ ràng, các thuật ngữ diễn giải "số ít" ("a" hoặc "an") như được sử dụng trong sáng chế này, tùy thuộc vào tính hướng, có thể có nghĩa là "một (1)", "một (1) hoặc nhiều" hoặc "ít nhất một (1)".

Rõ ràng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực là, các ví dụ viện dẫn trong sáng chế này không được xem xét theo cách giới hạn, mà chỉ mô tả chi tiết một số phương án.

Đối với tất cả các công thức mô tả ở đây, như các hệ vòng và các nhóm, các nguyên tử liền kề không thể là -O-O- hoặc -O-S-.

Các công thức cấu trúc có số lượng nguyên tử cacbon có thể thay đổi (các nguyên tử C) có thể được đề cập trong sáng chế này là $C_{\text{giới hạn dưới}}$ về số nguyên tử cacbon- $C_{\text{giới hạn trên}}$ về số nguyên tử cacbon công thức cấu trúc ($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$ công thức cấu trúc), như vậy để quy định cụ thể hơn. Ví dụ: nhóm alkyl có thể bao gồm 3 đến 10 nguyên tử cacbon và trường hợp này tương ứng với C_3-C_{10} -alkyl. Các cấu trúc vòng bao gồm nguyên tử cacbon và các nguyên tử khác loại có thể được đề cập ở dạng "LL- UL-số cạnh" công thức cấu trúc. Một ví dụ về cấu trúc vòng 6 cạnh là toluen (cấu trúc vòng 6 cạnh được thế bởi nhóm metyl).

Nếu thuật ngữ chung dùng cho phần tử thế, ví dụ ($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$)-alkyl, đặt ở cuối phần tử thế phức hợp, ví dụ ($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$)-xycloalkyl-($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$)-alkyl, thì thành phần cấu thành khởi đầu của phần tử thế phức hợp, ví dụ ($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$)-xycloalkyl, có thể được thế một lần hoặc nhiều lần giống nhau hoặc khác nhau và độc lập với phần tử thế nêu sau, ví dụ ($C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$)-alkyl. Tất cả các thuật ngữ chung sử dụng trong sáng chế này cho các nhóm hóa học, các hệ vòng và các nhóm vòng có thể được quy định cụ thể hơn thông qua việc bổ sung " $C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$ " hoặc "LL-UL-số cạnh".

Trừ khi được xác định theo cách khác, định nghĩa về thuật ngữ chung cũng áp dụng cho các thuật ngữ chung này trong các phần tử thế phức hợp. Ví dụ: định nghĩa về $C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$ -alkyl cũng áp dụng cho $C_{\text{LL}}-C_{\text{UL}}$ -alkyl là một phần của phần tử thế phức

hợp, ví dụ C_{LL}-C_{UL}-xycloalkyl-C_{LL}-C_{UL}-alkyl.

Trong định nghĩa về các ký hiệu nêu trong các công thức ở trên, các thuật ngữ chung mà thông thường đại diện cho các phần tử thể sau được sử dụng:

Halogen đề cập đến các nguyên tố thuộc nhóm chính thứ 7, tốt hơn là flo, clo, brom và iot, tốt hơn nữa là flo, clo và brom, và thậm chí tốt hơn nữa là flo và clo.

Ví dụ về các nguyên tử khác loại N, O, S, P, B, Si. Thuật ngữ "nguyên tử khác loại" tốt hơn đề cập đến N, S và O.

Theo sáng chế, "alkyl" – bản thân nó hoặc dưới dạng một phần của nhóm hóa học – là các hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 1,2-dimetylpropyl, 1,1-dimetylpropyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, hexyl, 1-metypentyl, 2-metypentyl, 3-metypentyl, 4-metypentyl, 1,2-dimetylpropyl, 1,3-dimetylbutyl, 1,4-dimetylbutyl, 2,3-dimetylbutyl, 1,1-dimetylbutyl, 2,2-dimetylbutyl, 3,3-dimetylbutyl, 1,1,2-trimetylpropyl, 1,2,2-trimetylpropyl, 1-etylbutyl và 2-etylbutyl. Cũng được ưu tiên là các alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl hoặc t-butyl. Alkyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkenyl" – bản thân nó hoặc là một phần của nhóm hóa học – là các hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon và ít nhất một liên kết đôi, ví dụ vinyl, 2-propenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-metyl-2-propenyl, 2-metyl-2-propenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-metyl-2-butenyl, 2-metyl-2-butenyl, 3-metyl-2-butenyl, 1-metyl-3-butenyl, 2-metyl-3-butenyl, 3-metyl-3-butenyl, 1,1-dimetyl-2-propenyl, 1,2-dimetyl-2-propenyl, 1-etyl-2-propenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-metyl-2-pentenyl, 2-metyl-2-pentenyl, 3-metyl-2-pentenyl, 4-metyl-2-pentenyl, 3-metyl-3-pentenyl, 4-metyl-3-pentenyl, 1-metyl-4-pentenyl, 2-metyl-4-pentenyl, 3-metyl-4-pentenyl, 4-metyl-4-pentenyl, 1,1-dimetyl-2-butenyl, 1,1-dimetyl-3-butenyl, 1,2-dimetyl-2-butenyl, 1,2-dimetyl-3-butenyl, 1,3-dimetyl-2-butenyl, 2,2-dimetyl-3-butenyl, 2,3-dimetyl-2-butenyl, 2,3-dimetyl-3-butenyl, 1-etyl-2-butenyl, 1-etyl-3-butenyl, 2-etyl-2-butenyl, 2-etyl-3-

butenyl, 1,1,2-trimetyl-2-propenyl, 1-etyl-1-metyl-2-propenyl và 1-etyl-2-metyl-2-propenyl. Cũng được ưu tiên là alkenyl có từ 2 đến 4 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, 2-propenyl, 2-butenyl hoặc 1-metyl-2-propenyl. Các alkenyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkynyl" – bản thân nó hoặc là một phần của nhóm hóa học – là các hydrocacbon mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon và ít nhất một liên kết ba, ví dụ 2-propynyl, 2-butynyl, 3-butynyl, 1-metyl-2-propynyl, 2-pentynyl, 3-pentynyl, 4-pentynyl, 1-metyl-3-butynyl, 2-metyl-3-butynyl, 1-metyl-2-butynyl, 1,1-dimetyl-2-propynyl, 1-etyl-2-propynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 1-metyl-2-pentynyl, 1-metyl-3-pentynyl, 1-metyl-4-pentynyl, 2-metyl-3-pentynyl, 2-metyl-4-pentynyl, 3-metyl-4-pentynyl, 4-metyl-2-pentynyl, 1,1-dimetyl-3-butynyl, 1,2-dimetyl-3-butynyl, 2,2-dimetyl-3-butynyl, 1-etyl-3-butynyl, 2-etyl-3-butynyl, 1-etyl-1-metyl-2-propynyl và 2,5-hexadiynyl. Cũng được ưu tiên là các alkynyl có từ 2 đến 4 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, etynyl, 2-propynyl hoặc 2-butynyl-2-propenyl. Các alkynyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "xycloalkyl" – bản thân nó hoặc là một phần của nhóm hóa học – là các hydrocacbon một, hai, hoặc ba vòng, tốt hơn có từ 3 đến 10 cacbon, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl, xyclooctyl, bixyclo[2.2.1]heptyl, bixyclo[2.2.2]octyl hoặc adamantyl. Cũng được ưu tiên là các xycloalkyl có 3, 4, 5, 6 hoặc 7 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, xyclopropyl hoặc xyclobutyl. Các xycloalkyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylxycloalkyl" là alkylxycloalkyl một, hai hoặc ba vòng, tốt hơn có từ 4 đến 10 hoặc từ 4 đến 7 nguyên tử cacbon, ví dụ metylxyclopropyl, etylxyclopropyl, isopropylxyclobutyl, 3-metylxyclopentyl và 4-metylxyclohexyl. Cũng được ưu tiên là các alkylxycloalkyl có 4, 5 hoặc 7 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, etylxyclopropyl hoặc 4-metylxyclohexyl. Các alkylxycloalkyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "xycloalkylalkyl" là xycloalkylalkyl một, hai hoặc ba vòng, tốt

hơn có từ 4 đến 10 hoặc từ 4 đến 7 nguyên tử cacbon, ví dụ xyclopropylmetyl, xyclobutylmetyl, xyclopentylmetyl, xyclohexylmetyl và xyclopentyletyl. Cũng được ưu tiên là các xycloalkylalkyl có 4, 5 hoặc 7 nguyên tử cacbon như, không kể các nhóm khác, xyclopropylmetyl hoặc xyclobutylmetyl. Các xycloalkylalkyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "hydroxyalkyl" là rượu mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, isobutanol, s-butanol và t-butanol. Cũng được ưu tiên là các nhóm hydroxyalkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm hydroxyalkyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkoxy" là O-alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metoxy, etoxy, n-propoxy, isopropoxy, n-butoxy, isobutoxy, s-butoxy và t-butoxy. Cũng được ưu tiên là các nhóm alkoxy có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm alkoxy theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylsulfanyl" là S-alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metylthio, etylthio, n-propylthio, isopropylthio, n-butylthio, isobutylthio, s-butylthio và t-butylthio. Cũng được ưu tiên là các nhóm alkylsulfanyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm alkylsulfanyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylsulfinyl" là alkylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metylsulphinyl, etylsulphinyl, n-propylsulphinyl, isopropylsulphinyl, n-butylsulphinyl, isobutylsulphinyl, s-butylsulphinyl và t-butylsulphinyl. Cũng được ưu tiên là các nhóm alkylsulfinyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm alkylsulfinyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylsulfonyl" là alkylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metylsulphonyl, etylsulphonyl, n-propylsulphonyl, isopropylsulphonyl, n-butylsulphonyl, isobutylsulphonyl, s-butylsulphonyl và t-butylsulphonyl. Cũng được ưu tiên là các nhóm alkylsulfonyl có

từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm alkylsulfonyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylcacbonyl" là alkyl-C(=O) mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 2 đến 7 nguyên tử cacbon như metylcacbonyl, etylcacbonyl, n-propylcacbonyl, isopropylcacbonyl, s-butylcacbonyl và t-butylcacbonyl. Cũng được ưu tiên là alkylcacbonyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Alkylcacbonyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "xycloalkylcacbonyl" là xycloalkylcacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 3 đến 10 nguyên tử cacbon ở phần xycloalkyl, ví dụ xyclopropylcacbonyl, xyclobutylcacbonyl, xyclopentylcacbonyl, xyclohexylcacbonyl, xycloheptylcacbonyl, xyclooctylcacbonyl, bixyclo[2.2.1]heptyl, bixyclo[2.2.2]octylcacbonyl và adamantylcacbonyl. Cũng được ưu tiên là xycloalkylcacbonyl có 3, 5 hoặc 7 nguyên tử cacbon ở phần xycloalkyl. Các nhóm xycloalkylcacbonyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkoxycacbonyl" - một mình hoặc làm thành phần cấu thành của nhóm hóa học - là alkoxycacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon hoặc có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon ở phần alkoxy, ví dụ metoxycacbonyl, etoxycacbonyl, n-propoxycacbonyl, isopropoxycacbonyl, s-butoxycacbonyl và t-butoxycacbonyl. Các nhóm alkoxycacbonyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "alkylaminocacbonyl" là alkylaminocacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon hoặc từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon ở phần alkyl, ví dụ metylaminocacbonyl, etylaminocacbonyl, n-propylaminocacbonyl, isopropylaminocacbonyl, s-butylaminocacbonyl và t-butylaminocacbonyl. Các nhóm alkylaminocacbonyl theo sáng chế có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "*N,N*-dialkylaminocacbonyl" là *N,N*-dialkylaminocacbonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, tốt hơn có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon hoặc từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon ở phần alkyl, ví dụ *N,N*-dimethylaminocacbonyl, *N,N*-diethylaminocacbonyl, *N,N*-di(n-propylamino)cacbonyl, *N,N*-di(isopropylamino)

cacbonyl và *N,N*-di-(*s*-butylamino)cacbonyl. Các nhóm *N,N*-dialkylaminocacbonyl theo sáng chế có thể được thế bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Theo sáng chế, "aryl" là hệ thơm một, hai hoặc đa vòng, tốt hơn có từ 6 đến 14, đặc biệt là từ 6 đến 10 nguyên tử cacbon vòng, ví dụ phenyl, naphthyl, antryl, phenantrenyl, tốt hơn là phenyl. Ngoài ra, aryl cũng là hệ đa vòng như tetrahydronaphthyl, indenyl, indanyl, florenyl, biphenyl, trong đó vị trí liên kết nằm ở trên hệ thơm. Các nhóm aryl theo sáng chế có thể được thế bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Ví dụ về các aryl được thế là arylalkyl, tương tự nhóm này có thể được thế bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau ở phần C₁-C₄-alkyl và/hoặc C₆-C₁₄-aryl. Ví dụ về arylalkyl như vậy bao gồm benzyl và 1-phenyletyl.

Theo sáng chế, "dị vòng", "vòng dị vòng" hoặc "hệ vòng dị vòng" là hệ vòng cacbon vòng có ít nhất một vòng, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại, tốt hơn là bằng nguyên tử khác loại từ nhóm bao gồm N, O, S, P, B, Si, Se, và hệ vòng này là no, không no hoặc dị vòng thơm và có thể không được thế hoặc được thế, trong đó vị trí liên kết nằm ở trên nguyên tử vòng. Trừ khi được xác định theo cách khác, vòng dị vòng tốt hơn chứa từ 3 đến 9 nguyên tử vòng, đặc biệt là từ 3 đến 6 nguyên tử vòng, và một hoặc nhiều, tốt hơn từ 1 đến 4, đặc biệt là 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại ở vòng dị vòng, tốt hơn là từ nhóm bao gồm N, O, và S, mặc dù hai nguyên tử oxy không được trực tiếp liền kề nhau. Các vòng dị vòng thường chứa không nhiều hơn 4 nguyên tử nitơ và/hoặc không nhiều hơn 2 nguyên tử oxy và/hoặc không nhiều hơn 2 nguyên tử lưu huỳnh. Khi gốc heteroxyclyl hoặc vòng dị vòng được thế tùy ý, nó có thể được ngưng tụ với các vòng cacbon vòng hoặc vòng dị vòng khác. Trong trường hợp heteroxyclyl được thế tùy ý, sáng chế cũng bao gồm các hệ đa vòng, ví dụ 8-azabixyclo[3.2.1]octanyl hoặc 1-azabixyclo[2.2.1]heptyl. Trong trường hợp heteroxyclyl được thế tùy ý, sáng chế cũng bao gồm các hệ vòng xoắn, ví dụ 1-oxa-5-azaspiro[2.3]hexyl.

Các nhóm heteroxyclyl theo sáng chế là, ví dụ, piperidinyl, piperazinyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, dihydropyranlyl, tetrahydropyranlyl, dioxanyl, pyrolinyl, pyrrolidinyl, imidazolinyl, imidazolidinyl, thiazolidinyl, oxazolidinyl, dioxolanyl,

dioxolyl, pyrazolidinyl, tetrahydrofuranyl, dihydrofuranyl, oxetanyl, oxiranyl, azetidiny, aziridinyl, oxazetidiny, oxaziridinyl, oxazepanyl, oxazinanyl, azepanyl, oxopyrolidinyl, dioxopyrolidinyl, oxomorpholinyl, oxopiperazinyl và oxepanyl.

Đặc biệt có ý nghĩa là các heteroaryl, tức là các hệ dị vòng thơm. Theo sáng chế, thuật ngữ heteroaryl để chỉ các hợp chất dị vòng thơm, tức là các hợp chất dị vòng thơm hoàn toàn không no, các hợp chất này nằm trong phạm vi định nghĩa về dị vòng nêu trên. Được ưu tiên là các hệ từ 5 đến 7 cạnh, có từ 1 đến 3, tốt hơn là 1 hoặc 2 nguyên tử khác loại giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm nêu trên. Các heteroaryl theo sáng chế là, ví dụ, furyl, thienyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,3- và 1,2,4-triazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- và 1,2,5-oxadiazolyl, azepinyl, pyrolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, 1,3,5-, 1,2,4- và 1,2,3-triazinyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- và 1,2,6-oxazinyl, oxepinyl, thiepinyl, 1,2,4-triazolonyl và 1,2,4-diazepinyl. Các nhóm heteroaryl theo sáng chế cũng có thể được thể bởi một hoặc nhiều gốc giống nhau hoặc khác nhau.

Thuật ngữ nhóm/phần tử thể "được thể (tùy ý)", như gốc alkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxy, alkylsulfanyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, xycloalkyl, aryl, phenyl, benzyl, heterocyclyl và heteroaryl được thể, có nghĩa là, ví dụ, gốc được thể dẫn xuất từ cấu trúc cơ bản không được thể, trong đó các phần tử thể, ví dụ, một (1) phần tử thể hoặc nhiều phần tử thể, tốt hơn là 1, 2, 3, 4, 5, 6 hoặc 7, được chọn từ nhóm gồm amino, hydroxyl, halogen, nitro, xyano, isoxyano, mercapto, isothioxyanato, C₁-C₄-cacboxyl, cacbonamit, SF₅, aminosulphonyl, C₁-C₄-alkyl, C₃-C₄-xycloalkyl, C₂-C₄-alkenyl, C₃-C₄-xycloalkenyl, C₂-C₄-alkynyl, *N*-mono-C₁-C₄-alkylamino, *N,N*-di-C₁-C₄-alkylamino, *N*-C₁-C₄-alkanoylamino, C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-alkenyloxy, C₂-C₄-alkynyloxy, C₃-C₄-xycloalkoxy, C₃-C₄-xycloalkenyloxy, C₁-C₄-alkoxycacbonyl, C₂-C₄-C₂-C₄-alkenyloxycacbonyl, C₂-C₄-alkynyloxycacbonyl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-aryloxycacbonyl, C₁-C₄-alkanoyl, C₂-C₄-alkenylcacbonyl, C₂-C₄-alkynylcacbonyl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-arylcacbonyl, C₁-C₄-alkylsulfanyl, C₃-C₄-xycloalkylsulfanyl, C₁-C₄-alkylthio, C₂-C₄-alkenylthio, C₃-C₄-xycloalkenylthio, C₂-C₄-alkynylthio, C₁-C₄-alkylsulphenyl và C₁-C₄-alkylsulfinyl, bao gồm cả các chất đồng phân đối ảnh của nhóm C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, *N*-mono-C₁-C₄-alkylaminosulphonyl, *N,N*-di-C₁-C₄-alkylaminosulphonyl, C₁-C₄-alkylphosphinyl, C₁-C₄-alkylphosphonyl, bao gồm cả các chất đồng

phân đổi ảnh của C₁-C₄-alkylphosphinyl và C₁-C₄-alkylphosphonyl, N-C₁-C₄-alkylaminocarbonyl, N,N-di-C₁-C₄-alkylaminocarbonyl, N-C₁-C₄-alkanoylamino-carbonyl, N-C₁-C₄-alkanoyl-N-C₁-C₄-alkylaminocarbonyl, C₆-,C₁₀-,C₁₄-aryl, C₆-,C₁₀-,C₁₄-aryloxy, benzyl, benzyloxy, benzylthio, C₆-,C₁₀-,C₁₄-arylthio, C₆-,C₁₀-,C₁₄-arylamino, benzylamino, heterocyclyl và trialkylsilyl, các phần tử thế được liên kết thông qua liên kết đôi, như C₁-C₄-alkyliden (ví dụ, metyliden hoặc etyliden), nhóm oxo, nhóm imino và nhóm imino được thế. Khi hai hoặc nhiều gốc tạo ra một hoặc nhiều vòng, các vòng này có thể là vòng cacbon, dị vòng, no, no một phần, không no, ví dụ bao gồm các vòng thơm và được thế thêm.

Các phần tử thế nêu ra theo cách ví dụ ("cấp phần tử thế thứ nhất") có thể, nếu chúng chứa các thành phần hydrocacbon, tùy ý được thế thêm trong đó ("cấp phần tử thế thứ hai"), ví dụ bằng một hoặc nhiều phần tử thế mà mỗi loại được chọn độc lập từ nhóm halogen, hydroxyl, amino, nitro, xyano, isoxyno, azido, axylamino, oxo và nhóm imino. Thuật ngữ nhóm "được thế (tùy ý)" tốt hơn chỉ bao gồm một hoặc hai cấp phần tử thế.

Các nhóm hóa học được thế halogen theo sáng chế (ví dụ, alkyl hoặc alkoxy) được thế một lần hoặc nhiều lần bằng halogen tới số lượng phần tử thế nhiều nhất có thể. Các nhóm như vậy cũng được gọi là nhóm halo (ví dụ, haloalkyl). Trong trường hợp thế nhiều lần bằng halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau, và tất cả có thể được liên kết với một nguyên tử cacbon hoặc có thể được liên kết với nhiều nguyên tử cacbon. Halogen cụ thể là flo, clo, brom hoặc iot, tốt hơn là flo, clo hoặc brom và tốt hơn nữa là flo. Các nhóm được thế halogen tốt hơn nữa là monohaloxycloalkyl như 1-floxyclopropyl, 2-floxyclopropyl hoặc 1-floxyclobutyl, monohaloalkyl như 2-cloetyl, 2-floetyl, 1-cloetyl, 1-floetyl, clometyl, hoặc flometyl; perhaloalkyl như triclometyl hoặc triflometyl hoặc CF₂CF₃, polyhaloalkyl như diflometyl, 2-flo-2-cloetyl, diclometyl, 1,1,2,2-tetrafloetyl hoặc 2,2,2-trifloetyl. Các ví dụ khác về haloalkyl là triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, clometyl, bromometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, pentaflloetyl, 3,3,3-triflopropyl và pentafllo-t-butyl. Được ưu tiên là các haloalkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon và từ 1 đến 9, tốt hơn từ 1 đến 5 nguyên tử halogen giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ flo, clo và brom. Đặc biệt được ưu

tiên là các haloalkyl có 1 hoặc 2 nguyên tử cacbon và từ 1 đến 5 nguyên tử halogen giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ flo và clo, như diflometyl, triflometyl hoặc 2,2-difloetyl, không kể các nhóm khác. Các ví dụ khác về hợp chất được thế halogen là haloalkoxy như OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCF_2CF_3 , OCH_2CF_3 , OCH_2CHF_2 và $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, các haloalkylsulfanyl như diflometylthio, triflometylthio, triclometylthio, clodiflometylthio, 1-floetylthio, 2-floetylthio, 2,2-difloetylthio, 1,1,2,2-tetrafloetylthio, 2,2,2-trifloetylthio hoặc 2-clo-1,1,2-trifloetylthio, các haloalkylsulfinyl như diflometylsulphinyl, triflometylsulphinyl, triclometylsulphinyl, clodiflometylsulphinyl, 1-floetylsulphinyl, 2-floetylsulphinyl, 2,2-difloetylsulphinyl, 1,1,2,2-tetrafloetylsulphinyl, 2,2,2-trifloetylsulphinyl và 2-clo-1,1,2-trifloetylsulphinyl, các haloalkylsulfinyl như diflometylsulphinyl, triflometylsulphinyl, triclometylsulphinyl, clodiflometylsulphinyl, 1-floetylsulphinyl, 2-floetylsulphinyl, 2,2-difloetylsulphinyl, 1,1,2,2-tetrafloetylsulphinyl, 2,2,2-trifloetylsulphinyl và 2-clo-1,1,2-trifloetylsulphinyl, các nhóm haloalkylsulfonyl như diflometylsulphonyl, triflometylsulphonyl, triclometylsulphonyl, clodiflometylsulphonyl, 1-floetylsulphonyl, 2-floetylsulphonyl, 2,2-difloetylsulphonyl, 1,1,2,2-tetrafloetylsulphonyl, 2,2,2-trifloetylsulphonyl và 2-clo-1,1,2-trifloetylsulphonyl.

Trong trường hợp các gốc có nguyên tử cacbon, tốt hơn là các gốc có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, đặc biệt là 1 hoặc 2 nguyên tử cacbon. Thông thường, được ưu tiên là các phần tử thế từ nhóm của halogen, ví dụ flo và clo, $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-alkyl}$, tốt hơn là metyl hoặc etyl, $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-haloalkyl}$, tốt hơn là triflometyl, $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-alkoxy}$, tốt hơn là metoxy hoặc etoxy, $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-haloalkoxy}$, nitro và xyano. Đặc biệt ưu tiên ở đây là các phần tử thế metyl, metoxy, flo và clo.

Amino được thế như amino được thế một lần hoặc hai lần có nghĩa là gốc từ nhóm các gốc amino được thế, các gốc này được thế *N*-, ví dụ, bởi một hoặc hai gốc giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm của alkyl, hydroxy, amino, alkoxy, axyl và aryl; tốt hơn là các nhóm *N*-mono- và *N,N*-dialkylamino, (ví dụ, metylamino, etylamino, *N,N*-dimetylamino, *N,N*-dietylamino, *N,N*-di-*n*-propylamino, *N,N*-diisopropylamino hoặc *N,N*-dibutylamino), *N*-mono- hoặc *N,N*-dialkoxyalkylamino (ví dụ, *N*-metoxymetylamino, *N*-metoxyetylamino, *N,N*-di(metoxymetyl)amino hoặc *N,N*-di(metoxietyl)amino), *N*-mono- và *N,N*-diarylamino, như các anilin được thế tùy ý,

axylamino, *N,N*-diaxylamino, *N*-alkyl-*N*-arylamino, *N*-alkyl-*N*-axylamino và cả các *N*-dị vòng no; được ưu tiên ở đây là các gốc alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon; ở đây, aryl tốt hơn là phenyl hoặc phenyl được thế; đối với axyl, định nghĩa đưa ra thêm dưới đây được áp dụng, tốt hơn là (C₁-C₄)-alkanoyl. Định nghĩa tương tự áp dụng cho hydroxylamino hoặc hydrazino được thế.

Theo sáng chế, thuật ngữ "nhóm amino vòng" bao gồm các hệ vòng dị vòng thơm hoặc béo có một hoặc nhiều nguyên tử nitơ. Các dị vòng là được thế hoặc không được thế, bao gồm một hoặc nhiều hệ vòng ngưng tụ tùy ý và tùy ý chứa thêm các nguyên tử khác loại, ví dụ một hoặc hai nguyên tử nitơ, oxy và/hoặc lưu huỳnh. Ngoài ra, thuật ngữ cũng bao gồm các nhóm có vòng xoắn hoặc hệ vòng có cầu. Số lượng nguyên tử tạo thành nhóm amino vòng không bị giới hạn và có thể bao gồm, ví dụ, trong trường hợp hệ một vòng có từ 3 đến 8 nguyên tử vòng, và trong trường hợp hệ hai vòng có từ 7 đến 11 nguyên tử.

Ví dụ về các nhóm amino vòng có các vòng một vòng no và không no có nguyên tử nitơ làm nguyên tử khác loại bao gồm 1-azetidiny, pyrrolidino, 2-pyrrolidin-1-yl, 1-pyrollyl, piperidino, 1,4-dihydropyrazin-1-yl, 1,2,5,6-tetrahydropyrazin-1-yl, 1,4-dihydropyridin-1-yl, 1,2,5,6-tetrahydropyridin-1-yl, homopiperidiny; ví dụ về các nhóm amino vòng có các vòng một vòng no và không no có hai hoặc nhiều nguyên tử nitơ làm nguyên tử khác loại bao gồm 1-imidazolidiny, 1-imidazolyl, 1-pyrazolyl, 1-triazolyl, 1-tetrazolyl, 1-piperaziny, 1-homopiperaziny, 1,2-dihydropiperazin-1-yl, 1,2-dihydropyrimidin-1-yl, perhydropyrimidin-1-yl, 1,4-diazaxycloheptan-1-yl; ví dụ về các nhóm amino vòng có các vòng một vòng no và không no có một hoặc hai nguyên tử oxy và từ 1 đến 3 nguyên tử nitơ làm nguyên tử khác loại, ví dụ, oxazolidin-3-yl, 2,3-dihydroisoxazol-2-yl, isoxazol-2-yl, 1,2,3-oxadiazin-2-yl, morpholino, ví dụ về các nhóm amino vòng có các vòng một vòng no và không no có từ 1 đến 3 nguyên tử nitơ và từ 1 đến 2 nguyên tử lưu huỳnh làm nguyên tử khác loại bao gồm thiazolidin-3-yl, isothiazolin-2-yl, thiomorpholino, hoặc dioxothiomorpholino; ví dụ về nhóm amino vòng có nhóm vòng ngưng tụ no và không no bao gồm indol-1-yl, 1,2-dihydrobenzimidazol-1-yl, perhydropyrol[1,2-*a*]pyrazin-2-yl; ví dụ về các nhóm amino vòng có các nhóm vòng xoắn bao gồm 2-azaspiro[4,5]decan-2-yl; ví dụ về các nhóm amino vòng có các nhóm dị vòng có cầu bao gồm 2-azabixyclo[2.2.1]heptan-7-

yl.

Amino được thế cũng bao gồm các hợp chất amoni bậc bốn (các muối) có 4 phân tử thế hữu cơ trên nguyên tử nitơ.

Phenyl được thế tùy ý tốt hơn là phenyl không được thế hoặc được thế một lần hoặc được thế nhiều lần, tốt hơn là được thế ba lần, bởi gốc giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm của halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkylsulfanyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfanyl, xyano, isoxyano và nitro, ví dụ o-, m- và p-tolyl, dimethylphenyl, 2-, 3- và 4-clophenyl, 2-, 3- và 4-flophenyl, 2-, 3- và 4-triflometyl- và -triclometylphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- và 2,3-diclophenyl, o-, m- và p-metoxyphenyl, 4-heptaflophenyl.

Xycloalkyl được thế tùy ý tốt hơn là xycloalkyl không được thế hoặc được thế một lần hoặc được thế nhiều lần, tốt hơn là được thế ba lần, bởi gốc giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm của halogen, xyano, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl và (C₁-C₄)-haloalkoxy, đặc biệt được thế bởi một hoặc hai gốc (C₁-C₄)-alkyl.

Heteroxyclyl được thế tùy ý tốt hơn là heteroxyclyl không được thế hoặc được thế một lần hoặc được thế nhiều lần, tốt hơn là được thế ba lần, bởi gốc giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm của halogen, xyano, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy, nitro và oxo, đặc biệt là được thế một lần hoặc được thế nhiều lần bởi các gốc từ nhóm của halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkyl và oxo, tốt nhất là được thế bởi một hoặc hai gốc (C₁-C₄)-alkyl.

Ví dụ về các heteroaryl được thế alkyl là furylmetyl, thienylmetyl, pyrazolylmetyl, imidazolylmetyl, 1,2,3- và 1,2,4-triazolylmetyl, isoxazolylmetyl, thiazolylmetyl, isothiazolylmetyl, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- và 1,2,5-oxadiazolylmetyl, azepinylmetyl, pyrolylmetyl, pyridylmetyl, pyridazinylmetyl, pyrimidinylmetyl, pyrazinylmetyl, 1,3,5-, 1,2,4- và 1,2,3-triazinylmetyl, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- và 1,2,6-oxazinylmetyl, oxepinylmetyl, thiopinylmetyl và 1,2,4-diazepinylmetyl.

Hợp chất theo sáng chế có thể xuất hiện trong các phương án ưu tiên. Từng phương án riêng biệt mô tả ở đây có thể được kết hợp với nhau. Không được bao gồm là những sự kết hợp mà trái với quy luật tự nhiên và do đó, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực sẽ bác bỏ trên cơ sở kiến thức chuyên gia của họ. Ví dụ, các cấu trúc vòng có 3 hoặc nhiều hơn 3 nguyên tử oxy liên kế được loại trừ.

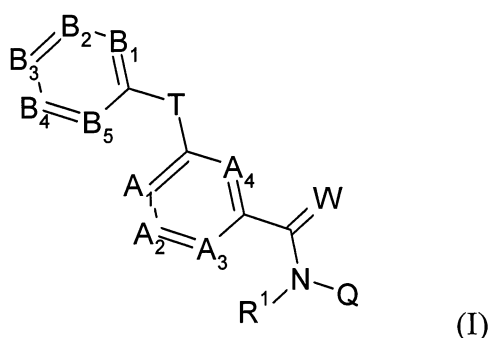
Phương án về các hợp chất theo sáng chế

Rõ ràng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực rằng, tất cả mọi phương án có thể có mặt ở dạng đơn hoặc kết hợp.

Hợp chất có công thức (I), nhất là các hợp chất có công thức (Ia), (Ib), (Ic), (Id) và (Ie), trường hợp thích hợp, tùy thuộc vào bản chất của phần tử thế, có thể ở dạng muối, chất hỗ biến, chất đồng phân dị hình và/hoặc chất đồng phân quang hoạt hoặc các hỗn hợp đồng phân tương ứng trong các hợp phần khác nhau.

Trường hợp thích hợp, hợp chất theo sáng chế có thể ở dạng đa hình khác nhau hoặc ở dạng hỗn hợp của các dạng đa hình khác nhau. Cả dạng đa hình tinh khiết và hỗn hợp đa hình tạo thành một phần nội dung của sáng chế và có thể được sử dụng theo sáng chế.

Các phương án về hợp chất có công thức (I) được mô tả chi tiết dưới đây:



trong đó:

R^1 là H, trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, aryl(C_1 - C_3)-alkyl, heteroaryl(C_1 - C_3)-alkyl được thế tùy ý,

các gốc tiếp theo là như sau:

A₁ là CR² hoặc N,

A₂ là CR³ hoặc N,

A₃ là CR⁴ hoặc N,

A₄ là CR⁵ hoặc N,

B₁ là CR⁶ hoặc N,

B₂ là CR⁷ hoặc N,

B₃ là CR⁸ hoặc N,

B₄ là CR⁹ hoặc N, và

B₅ là CR¹⁰ hoặc N,

nhưng không nhiều hơn 3 trong số các gốc từ A₁ đến A₄ là N và không nhiều hơn 3 trong số các gốc từ B₁ đến B₅ đồng thời là N;

mỗi gốc R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹ và R¹⁰ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₆-alkylamino được thể tùy ý;

nếu như không gốc nào trong số các gốc A₂ và A₃ là N, thì R³ và R⁴ cùng với nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng có 5 hoặc 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử oxy và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử lưu huỳnh, hoặc

nếu không có gốc nào trong số các gốc A₁ và A₂ là N, thì R² và R³ cùng với nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ;

R⁸ là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₆-alkylamino được thể tùy ý;

W là O hoặc S;

Q là H, formyl, hydroxyl, amino hoặc trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₅-heteroxycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₆-alkyl-C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₆-alkyl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-aryl, C₁-C₅-heteroaryl, C₆-, C₁₀-, C₁₄-aryl-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₅-heteroaryl-C₁-C₃-alkyl, N-C₁-C₄-alkylamino, N-C₁-C₄-alkylcarbonylamino, hoặc N,N-di-C₁-C₄-alkylamino được thế tùy ý; hoặc

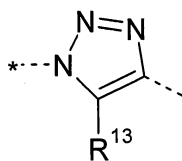
là vòng cacbon 6 cạnh không no tùy ý được thế poly-V; hoặc

là vòng dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh không no tùy ý được thế poly-V, trong đó

V độc lập là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp, là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkenyl, C₁-C₄-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, N-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, hoặc N,N-di-(C₁-C₆-alkyl)amino được thế tùy ý;

T trong mỗi trường hợp là hệ dị vòng thơm 5 cạnh được thế tùy ý chứa 3 nguyên tử khác loại, tốt hơn được chọn từ nhóm gồm N, O và S,

và muối, N-oxit và các dạng hỗ biến của hợp chất có công thức (I),



với điều kiện T không phải là

trong đó, R¹³ là H, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkyl được thế halogen hoặc xyano.

Theo một phương án ưu tiên, R¹ trong hợp chất có công thức (I) là H, trong mỗi trường hợp là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, s-butyl, t-butyl, metoxymetyl, etoxymetyl, propoxymetyl, methylcarbonyl, ethylcarbonyl, n-propylcarbonyl, isopropylcarbonyl, s-butylcarbonyl, t-butylcarbonyl, metoxycarbonyl, etoxycarbonyl, n-propoxycarbonyl, isopropoxycarbonyl, s-butoxycarbonyl, t-butoxycarbonyl, xyanometyl, 2-xyanoetyl, benzyl, 4-metoxybenzyl, pyrid-2-ylmetyl, pyrid-3-ylmetyl, pyrid-4-ylmetyl, 4-clopyrid-3-ylmetyl được thế tùy ý. Theo một phương án ưu tiên hơn nữa, R¹ là H.

Theo phương án ưu tiên khác, W là O.

Theo phương án ưu tiên khác, Q là H, trong mỗi trường hợp là metyl, etyl, n-propyl, 1-metyletyl, 1,1-dimetyletyl, 1-metylpropyl, n-butyl, 2-metylpropyl, 2-metylbutyl, hydroxymetyl, 2-hydroxypropyl, xyanometyl, 2-xyanoetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1-triflometyletyl, 2,2-diflopropyl, 3,3,3-triflopropyl, 2,2-dimetyl-3-flopropyl, xyclopropyl, 1-xyanoxyclopropyl, 1-metoxycacbonyl-xyclopropyl, 1-(*N*-metylcacbamoyl)xyclopropyl, 1-(*N*-xyclopropylcacbamoyl)xyclopropyl, xyclopropylmetyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, 1-xyclopropyletyl, bis(xyclopropyl)metyl, 2,2-dimetylxyclopropylmetyl, 2-phenylxyclopropyl, 2,2-dicloxyclopropyl, trans-2-cloxyclopropyl, cis-2-cloxyclopropyl, 2,2-difloxyclopropyl, trans-2-floxyclopropyl, cis-2-floxyclopropyl, trans-4-hydroxyxyclohexyl, 4-triflometylxyclohexyl, prop-2-enyl, 2-metylprop-2-enyl, prop-2-ynyl, 1,1-dimetylbut-2-ynyl, 3-cloprop-2-enyl, 3,3-dicloprop-2-enyl, 3,3-diclo-1,1-dimetylprop-2-enyl, phenyl, 2-clophenyl, 3-clophenyl, 4-clophenyl, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, isoxazol-3-ylmetyl, 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamino)etyl, 1,2,4-triazol-3-ylmetyl, 3-metyloxetan-3-ylmetyl, benzyl, 2,6-diflophenylmetyl, 3-flophenylmetyl, 2-flophenylmetyl, 2,5-diflophenylmetyl, 1-phenyletyl, 4-clophenyletyl, 2-triflometylphenyletyl, 1-pyridin-2-yletyl, pyridin-2-ylmetyl, 5-flopyridin-2-ylmetyl, (6-clopyridin-3-yl)metyl, pyrimidin-2-ylmetyl, metoxy, 2-etoxyetyl, 2-(metylsulphanyl)etyl, 1-metyl-2-(etylsulphanyl)etyl, 2-metyl-1-(metylsulphanyl)propan-2-yl, metoxycacbonyl, metoxycacbonylmetyl, NH₂, *N*-etylamino, *N*-allylamino, *N,N*-dimetylamino, *N,N*-dietylamino được thế tùy ý; hoặc

Q là một trong số các nhóm sau, mỗi nhóm được thế bởi từ 0 đến 4 phần tử thế V: phenyl, naphtyl, pyridazin, pyrazin, pyrimidin, triazin, pyridin, pyrazol, thiazol, isothiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furan, thiophen, pyrol, oxadiazol, thiadiazol, trong đó:

V độc lập là F, Cl, Br, I, xyano, nitro, metyl, etyl, diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, clometyl, bromometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentafloetyl, heptaflon-propyl,

heptaflorisopropyl, nonaflor-n-butyl, xyclopropyl, xyclobutyl, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyloxy, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxyl, 2-clo-2,2-difloetoxyl, pentafloroxyl, *N*-metoxyiminometyl, 1-(*N*-metoxyimino)etyl, metylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphanyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphanyl, triflometylsulphanyl, *N,N*-dimetylamino.

Theo phương án ưu tiên hơn nữa, Q là C₁-C₄-alkyl được thế flo như 2,2,2-trifloetyl, 2,2-difloetyl, 3,3,3-triflopropyl; C₃-C₄-xycloalkyl như xyclopropyl hoặc xyclobutyl; C₃-C₄-xycloalkyl được thế tùy ý như 1-xyanoxyclopropyl, trans-2-floxypropyl, hoặc cis-2-floxypropyl; C₄-C₆-heteroxycloalkyl như oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl hoặc 1,1-dioxidothietan-3-yl; benzyl; pyridin-2-ylmetyl; metylsulphonyl; hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamino)etyl.

Theo phương án đặc biệt ưu tiên, Q là C₁-C₃-alkyl được thế flo như 2,2,2-trifloetyl hoặc 3,3,3-triflopropyl; xyclopropyl; được thế tùy ý xyclopropyl như 1-xyanoxyclopropyl hoặc 1-triflometylxyclopropyl, thietan-3-yl; hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetyl)aminoetyl.

Theo phương án ưu tiên, không nhiều hơn một (1) gốc từ A₁ đến A₄ là N (nói cách khác: một (1) gốc từ A₁ đến A₄ (tốt hơn là A₂) là N); hoặc không (0) gốc nào từ A₁ đến A₄ là N (nói cách khác: mỗi gốc từ A₁ đến A₄ là CR², CR³, CR⁴, và CR⁵).

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi gốc R², R³, R⁴ và R⁵ (nếu gốc A tương ứng là CR) trong hợp chất có công thức (I) độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C₁-C₄-alkyl, C₃-C₄-xycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, *N*-C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfanyl, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₄-alkylamino, hoặc *N,N*-di-C₁-C₄-alkylamino được thế tùy ý.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi gốc R² và R⁵ độc lập là H, metyl, F và Cl.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi gốc R³ và R⁴ độc lập là H, F, Cl, Br, I, xyano, nitro, metyl, etyl, flometyl, diflometyl, clodiflometyl, triflometyl, 2,2,2-trifloetyl, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyloxy, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxyl, 2-clo-2,2-difloetoxyl,

pentafluoetoxy, N-metoxyliminometyl, 1-(N-metoxylimino)etyl, metylsulphanyl, triflometylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphinyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl.

Theo phương án ưu tiên, không nhiều hơn một (1) gốc từ B₁ đến B₅ là N (nói cách khác: một (1) gốc từ B₁ đến B₅ là N); hoặc không (0) gốc nào từ B₁ đến B₅ là N (nói cách khác: mỗi gốc từ B₁ đến B₅ là CR⁶, CR⁷, CR⁸, CR⁹ và CR¹⁰).

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi một gốc R⁶, R⁷, R⁹ và R¹⁰ (khi gốc B tương ứng là CR) độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C₁-C₄-alkyl, C₃-C₄-xycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, N-alkoxyiminooalkyl, C₁-C₄-alkylsulfanyl, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, N-C₁-C₄-alkylamino, N,N-di-C₁-C₄-alkylamino được thể tùy ý.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi một gốc R⁶, R⁷, R⁹ và R¹⁰ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, metyl, etyl, flometyl, diflometyl, clodiflometyl, triflometyl, 2,2,2-trifloetyl, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyletoxy, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-clo-2,2-difloetoxy, pentafluoetoxy, N-metoxyliminometyl, 1-(N-metoxylimino)etyl, metylsulphanyl, triflometylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphinyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi một gốc R⁶ và R¹⁰ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, metyl, etyl, diflometyl, clodiflometyl, triflometyl, metoxy, etoxy, 1-metyletoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-clo-2,2-difloetoxy, metylsulphanyl, triflometylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphinyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl.

Theo phương án ưu tiên khác, gốc R⁶ và R¹⁰ là các phần tử thể mô tả ở đây, nhưng gốc R⁶ và R¹⁰ trong một hợp chất cả hai không phải là H. Nói cách khác, khi R⁶ trong hợp chất là H, R¹⁰ là một trong số các phần tử thể khác mô tả ở đây, và ngược lại.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi một gốc R⁶ và R¹⁰ là phần tử thể được chọn từ halogen (như Cl hoặc F), C₁-C₃-alkyl, C₁-C₃-alkyl halogen hóa, C₁-C₃-alkoxy và

C₁-C₃-alkoxy halogen hóa.

Theo phương án ưu tiên khác, mỗi một gốc R⁶ và R¹⁰ là halogen (như Cl hoặc F), mỗi một gốc là C₁-C₃-alkyl, hoặc mỗi một gốc là C₁-C₃-alkyl halogen hóa, ví dụ C₁-C₃-alkyl perflo hóa (ví dụ, perflopropyl).

R⁸

Theo phương án ưu tiên khác, R⁸ trong hợp chất có công thức (I) là halogen, xyano, nitro, C₁-C₄-alkyl được thế halogen, C₃-C₄-xycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, *N*-C₁-C₄-alkoxyimino-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfanyl, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₄-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₄-alkylamino.

Theo phương án ưu tiên khác, R⁸ là halogen hoặc C₁-C₄-alkyl được thế halogen như flo, clo, brom, iot, xyano, nitro, metyl, etyl, diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, clometyl, bromometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentafloetyl, pentaflo-tert-butyl, heptaflo-n-propyl, heptaflorisopropyl, nonaflo-n-butyl, nonaflo-sec-butyl, xyclopropyl, xyclobutyl, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyletoxy, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, pentafloetoxo, *N*-metoxyiminometyl, 1-(*N*-metoxyimino)etyl, metylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphinyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl, triflometylsulphanyl, *N,N*-dimetylamino.

Theo phương án ưu tiên hơn nữa, R⁸ là diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentafloetyl, pentaflo-tert-butyl, heptaflo-n-propyl, heptaflorisopropyl, nonaflo-n-butyl, nonaflo-sec-butyl, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, pentafloetoxo, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl, triflometylsulphanyl.

Theo phương án đặc biệt ưu tiên, R⁸ là C₁-C₃-alkyl perflo hóa như *n*- hoặc *i*-propyl perflo hóa (-C₃F₇), etyl perflo hóa (C₂F₅) hoặc metyl perflo hóa (CF₃), tốt hơn

nữa là n- hoặc i-propyl perflo hóa ($-C_3F_7$) hoặc metyl perflo hóa.

Theo phương án ưu tiên khác, các gốc từ A_1 đến A_4 và từ B_1 đến B_5 trong hợp chất có công thức (I) là như sau:

A_1 là C-H,

A_2 là CR^3 hoặc N,

A_3 là CR^4 ,

A_4 là CR^5 hoặc N,

B_1 là CR^6 hoặc N,

B_2 là CR^7 ,

B_3 là CR^8 ,

B_4 là CR^9 và

B_5 là CR^{10} hoặc N.

Theo phương án được ưu tiên hơn nữa, các gốc từ A_1 đến A_4 và từ B_1 đến B_5 trong hợp chất có công thức (I) là như sau:

A_1 là C-H,

A_2 là CR^3 hoặc N,

A_3 là CR^4 ,

A_4 là C-H,

B_1 là CR^6 hoặc N,

B_2 là C-H,

B_3 là CR^8 ,

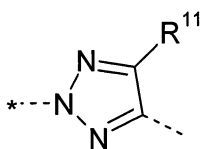
B_4 là C-H và

B_5 là CR^{10} hoặc N.

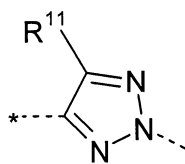
T

Theo phương án ưu tiên khác, T là một trong các hệ dị vòng thơm 5 cạnh được

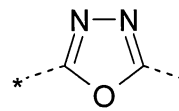
thể hiện dưới đây, trong đó liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-B₁-B₅) được nhận diện bằng liên kết đường chấm được đánh dấu bằng dấu sao, và liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-A₁-A₂-A₃-C-A₄) được nhận diện bằng đường chấm



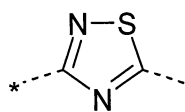
T6



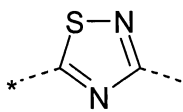
T7



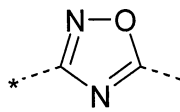
T17



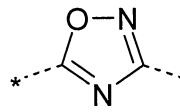
T36



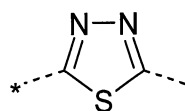
T37



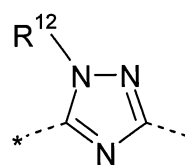
T38



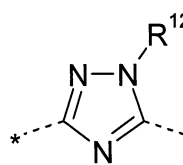
T39



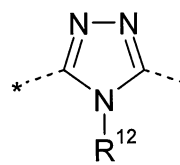
T40



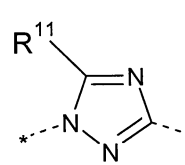
T41



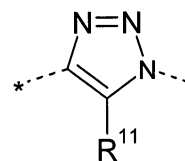
T42



T43



T44



T48

trong đó:

R^{11} độc lập là H, halogen, xyano, nitro, amino hoặc trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkyloxy, C_1 - C_6 -alkylcacbonyl, C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được thế tùy ý, tốt hơn là H; và

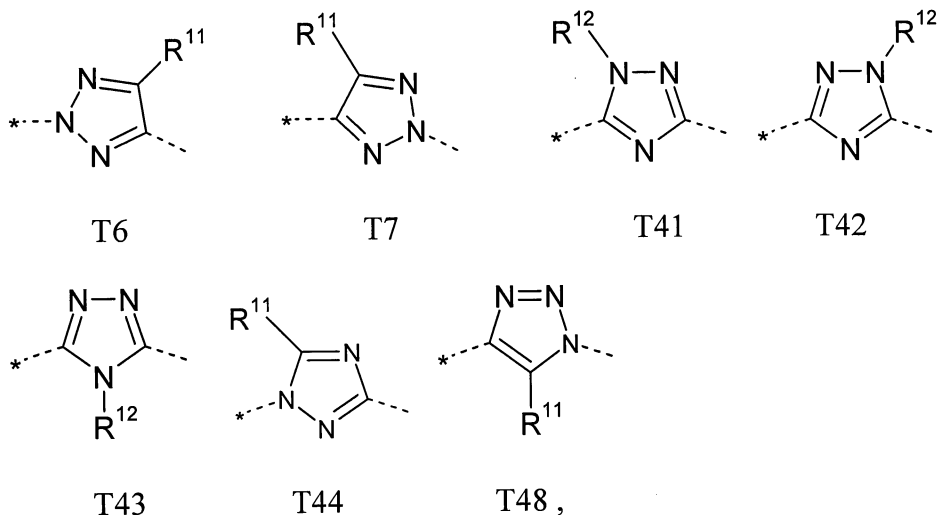
n có giá trị bằng 0 hoặc 1; và

R^{12} là H, halogen, xyano, nitro, amino hoặc C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkyloxy, C_1 - C_6 -alkylcacbonyl, C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được thế tùy ý, tốt hơn là H hoặc metyl.

Theo phương án ưu tiên khác, R^{11} là H, halogen, xyano, nitro, amino, metyl, etyl, 1-metyletyl, tert-butyl, triflometyl, diflometyl, metoxy, etoxy, triflometoxy, 2,2-difloetoxi, 2,2,2-trifloetoxi, metylcacbonyl, etylcacbonyl, triflometylcacbonyl, metylsulphanyl, metylsulphinyl, metylsulphonyl, triflometylsulphonyl, triflometylsulphanyl hoặc triflometylsulphinyl.

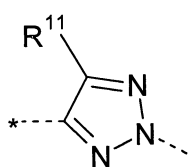
Theo phương án ưu tiên hơn nữa, R^{11} là H, metyl, etyl, 2-metyletyl, 2,2-dimetyletyl, flo, clo, brom, iot, nitro, triflometyl hoặc amino.

Theo phương án ưu tiên khác, T là một trong các hệ dị vòng thom 5 cạnh được thể hiện dưới đây, trong đó liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-B₁-B₅) được nhận diện bằng liên kết đường chấm có đánh dấu sao, và liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-A₁-A₂-A₃-C-A₄) được nhận diện bằng đường chấm

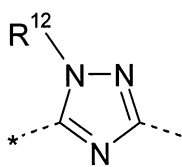


trong đó, mỗi một gốc R^{11} và R^{12} được xác định theo như mô tả ở đây.

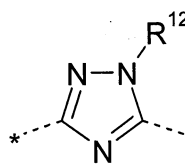
Theo một phương án đặc biệt ưu tiên, T là một trong số các hệ dị vòng thơm 5 cạnh được thể hiện dưới đây, trong đó liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-B₁-B₅) được nhận diện bởi liên kết đường chấm có đánh dấu sao, và liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-A₁-A₂-A₃-C-A₄) được nhận diện bởi đường chấm



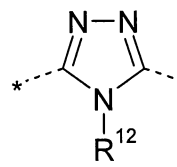
T7



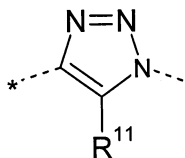
T41



T42



T43



T48 ,

trong đó, mỗi một gốc R^{11} và R^{12} được xác định theo như mô tả ở đây.

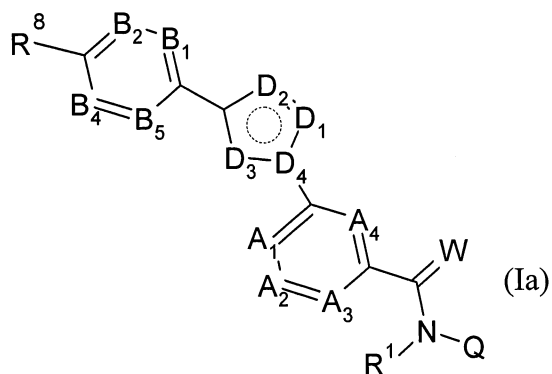
Theo phương án đặc biệt ưu tiên khác, T là một trong số các hệ dị vòng thơm 5 cạnh được thể hiện dưới đây, trong đó liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-B₁-B₅) được nhận diện bằng liên kết đường chấm có đánh dấu sao, và liên kết với nguyên tử cacbon của hệ vòng (C-A₁-A₂-A₃-C-A₄) được nhận diện bằng liên kết đường chấm



T48,

trong đó, R^{11} được xác định theo như mô tả ở đây.

Phương án ưu tiên khác đề cập thêm đến hợp chất có công thức (Ia)



trong đó:

mỗi một gốc R^1 , R^{11} , Q, W, A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , B_1 , B_2 , B_3 , B_4 và B_5 được xác định theo như mô tả ở đây, trong đó không nhiều hơn một gốc được chọn từ A_1 , A_2 , A_3 , A_4 là N và không nhiều hơn một gốc được chọn từ B_1 , B_2 , B_3 , B_4 và B_5 là N; và

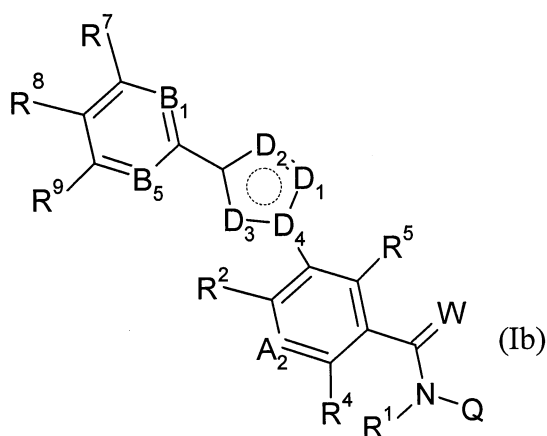
mỗi một gốc D_1 , D_2 và D_3 độc lập là $C-R^{11}$ hoặc nguyên tử khác loại, tốt hơn là $C-R^{11}$ hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S; và

D_4 là C hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N;

trong đó, ba gốc được chọn từ D_1 , D_2 , D_3 và D_4 là nguyên tử khác loại; và

 là hệ thơm.

Phương án ưu tiên khác đề cập thêm đến hợp chất có công thức (Ib)



trong đó:

mỗi một gốc R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{11} , Q, W, A_2 , B_1 và B_5 được xác định theo như mô tả ở đây;

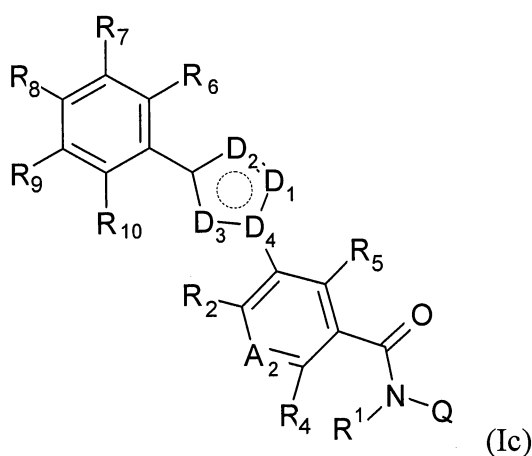
mỗi một gốc D_1 , D_2 và D_3 độc lập là $C-R^{11}$ hoặc nguyên tử khác loại, tốt hơn là $C-R^{11}$ hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S; và

D_4 là C hoặc nguyên tử khác loại được chọn từ N;

trong đó, ba gốc được chọn từ D_1 , D_2 , D_3 và D_4 là nguyên tử khác loại; và

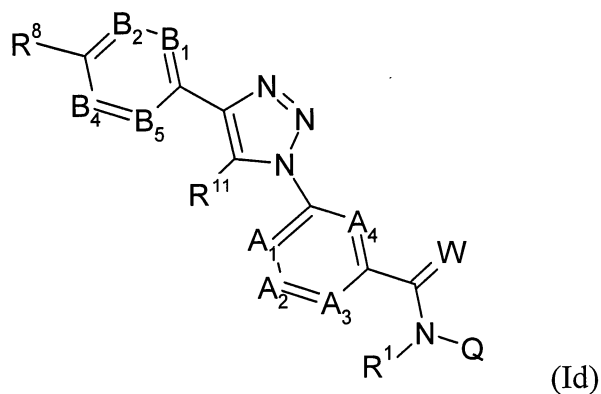
○ là hệ thơm.

Phương án ưu tiên khác đề cập đến hợp chất có công thức (Ic)



trong đó, mỗi một gốc R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , A_2 , Q , D_1 , D_2 , D_3 và ○ được xác định theo như mô tả ở đây.

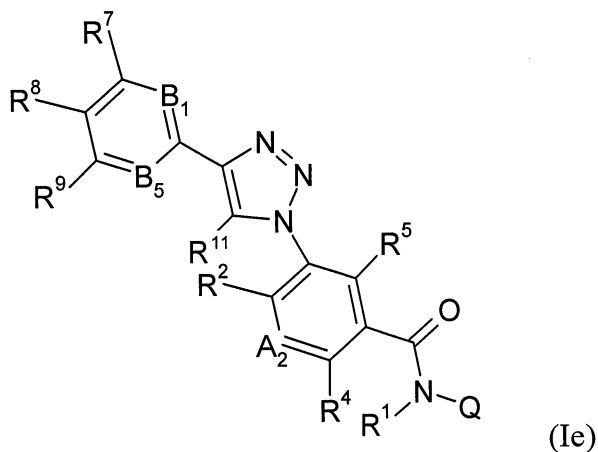
Phương án ưu tiên khác đề cập đến hợp chất có công thức (Id):



trong đó, mỗi một gốc R^1 , R^8 , R^{11} , Q, W, A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , B_1 , B_2 , B_3 , B_4 và B_5 được xác định theo như mô tả ở đây,

trong đó, không nhiều hơn một gốc được chọn từ A_1 , A_2 , A_3 , A_4 là N và không nhiều hơn một gốc được chọn từ B_1 , B_2 , B_3 , B_4 và B_5 là N.

Phương án ưu tiên khác đề cập đến hợp chất có công thức (Ie):



trong đó, mỗi một gốc R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{11} , Q, A_2 , B_1 và B_5 được xác định theo như mô tả ở đây.

Phương án đặc biệt ưu tiên đề cập đến hợp chất có công thức (I), (Ia), (Ib), (Ic), (Id) hoặc (Ie) trong đó, R^8 là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkyl halogen hóa, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl halogen hóa, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkoxy halogen hóa, *N*-alkoxyiminoalkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfanyl halogen hóa, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl halogen hóa, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl halogen hóa, *N*- C_1 - C_6 -alkylamino, *N,N*-di- C_1 - C_4 -alkylamino, và là flo, clo, brom, iot, xyano hoặc nitro. Các ví dụ đó là flo, clo, brom, iot, xyano, nitro, metyl, etyl, diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, clometyl, bromometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentaflloetyl, pentafllo-tert-butyl, heptafllo-n-propyl, heptaflloisopropyl, nonafllo-n-butyl, nonafllo-sec-butyl, xyclopropyl, xyclobutyl, metoxy, etoxy, n-propoxy, 1-metyletoxy, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, pentaflloetoxo, *N*-metoxyiminometyl, 1-(*N*-metoxyimino)etyl, metylsulphanyl, metylsulphonyl, metylsulphinyl, triflometylsulphonyl,

triflometylsulphinyl, triflometylsulphanyl, *N,N*-dimetylamino. R⁸ tốt hơn nữa là C₁-C₄-alkyl halogen hóa như diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentafloetyl, pentaflo-tert-butyl, heptaflon-propyl, heptaflorisopropyl, nonaflon-n-butyl, nonaflon-sec-butyl; C₁-C₄-alkoxy halogen hóa như flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, pentaflometoxo; triflometylsulphonyl; triflometylsulphinyl; hoặc triflometylsulphanyl. R⁸ thậm chí tốt hơn nữa là diflometyl, triclometyl, clodiflometyl, dicloflometyl, triflometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 1,2,2,2-tetrafloetyl, 1-clo-1,2,2,2-tetrafloetyl, 2,2,2-tricloetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 1,1-difloetyl, pentafloetyl, pentaflo-tert-butyl, heptaflon-propyl, heptaflorisopropyl, nonaflon-n-butyl, nonaflon-sec-butyl, flometoxy, diflometoxy, clodiflometoxy, dicloflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2,2-difloetoxo, pentaflometoxo, triflometylsulphonyl, triflometylsulphinyl hoặc triflometylsulphanyl.

R⁸ trong hợp chất có công thức (Ib) tốt hơn nữa là C₁-C₃-alkyl perflo hóa như propyl perflo hóa (-C₃F₇), etyl perflo hóa (C₂F₅) hoặc metyl perflo hóa (CF₃), tốt nhất là propyl perflo hóa (-C₃F₇) hoặc metyl perflo hóa.

Muối của hợp chất theo sáng chế là thích hợp theo sáng chế, ví dụ muối với kiềm hoặc muối cộng axit, tất cả là các muối không độc thông thường, tốt hơn là muối được chấp nhận trong nông nghiệp và/hoặc sinh lý. Được ưu tiên là muối với kiềm vô cơ, ví dụ muối với kim loại kiềm (ví dụ, các muối natri, kali hoặc xesi), muối với kim loại kiềm thổ (ví dụ, các muối canxi hoặc magie), muối amoni hoặc muối với kiềm hữu cơ, đặc biệt là muối với amin hữu cơ, ví dụ các muối trietylamoni, dicyclohexylamoni, *N,N'*-dibenzyletylendiamoni, pyridin, picolin hoặc etanolamoni, muối với axit vô cơ (ví dụ, hydroclorua, hydrobromua, dihydrosulphat, trihydrosulphat hoặc phosphat), muối với axit cacboxylic hữu cơ hoặc axit sulpho hữu cơ (ví dụ, format, axetat, trifloaxetat, maleat, tartrat, metansulphonat, benzensulphonat hoặc 4-toluensulphonat). Đã biết rõ rằng, các t-amin, ví dụ một số trong số các hợp chất theo sáng chế, có khả năng tạo ra *N*-oxit, tương tự cũng là muối theo sáng chế.

Tùy thuộc vào bản chất của phần tử thể, hợp chất có công thức (I) có thể ở dạng chất đồng phân dị hình và/hoặc chất đồng phân quang hoạt hoặc hỗn hợp đồng phân tương ứng trong các hợp phần khác nhau. Ví dụ, các chất đồng phân lập thể này là chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân atrop hoặc chất đồng phân dị hình. Do đó, sáng chế bao gồm cả các chất đồng phân lập thể tinh khiết và hỗn hợp bất kỳ của các chất đồng phân này.

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ động vật gây hại, trong đó hợp chất có công thức (I) được cho tác động lên động vật gây hại và/hoặc nơi ở của chúng. Phòng trừ động vật gây hại tốt hơn được tiến hành trong nông và lâm nghiệp và trong bảo vệ nguyên liệu. Tốt hơn là loại trừ phương pháp điều trị ngoại khoa hoặc bằng thuốc trên cơ thể người hoặc động vật và phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Bản mô tả bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm chất diệt sinh vật gây hại, nhất là làm chất bảo vệ cây trồng.

Trong bối cảnh của sáng chế này, thuật ngữ "chất diệt sinh vật gây hại" cũng luôn luôn bao gồm thuật ngữ "chất bảo vệ cây trồng".

Hợp chất có công thức (I), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật máu nóng và tương thích tốt với môi trường, thích hợp trong bảo vệ thực vật và các bộ phận của thực vật chống lại các yếu tố kích thích sinh học và phi sinh học, để gia tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, nhất là côn trùng, nhện, giun sán, giun tròn và động vật thân mềm, các loại này thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong trồng rừng, trong các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu bảo quản, và trong khu vực vệ sinh. Các hợp chất này tốt hơn được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại. Chúng có hoạt tính chống lại các loài nhạy cảm và kháng thuốc thông thường và chống lại tất cả hoặc một số giai đoạn phát triển. Các sinh vật gây hại đề cập trên đây bao gồm:

sinh vật gây hại thuộc ngành chân khớp (*Arthropoda*), nhất là từ lớp nhện (*Arachnida*), ví dụ *Acarus spp.*, ví dụ *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp.*, *Aculus spp.*, ví dụ *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma*

spp., *Amphitetranynchus viennensis*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, ví dụ *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides spp.*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor spp.*, *Eotetranychus spp.*, ví dụ *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus spp.*, ví dụ *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes spp.*, ví dụ *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus spp.*, ví dụ *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Latrodectus spp.*, *Loxosceles spp.*, *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphersa spp.*, *Oligonychus spp.*, ví dụ *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yotheri*, *Ornithodoros spp.*, *Ornithonyssus spp.*, *Panonychus spp.*, ví dụ *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus spp.*, *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus spp.*, ví dụ *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus spp.*, ví dụ *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestani*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis spp.*, *Vasates lycopersici*;

thuộc lớp chân môi (*Chilopoda*), ví dụ *Geophilus spp.*, *Scutigera spp.*;

thuộc bộ hoặc lớp đuôi bật (*Collembola*), ví dụ *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

thuộc lớp chân kép (*Diplopoda*), ví dụ *Blaniulus guttulatus*;

thuộc lớp côn trùng (*Insecta*), ví dụ thuộc bộ gián (*Blattodea*), ví dụ *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta spp.*, ví dụ *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

thuộc bộ cánh cứng (*Coleoptera*), ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp.*, *Agelastica alni*, *Agriotes spp.*, ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*,

Anoplophora spp., *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *antrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caeruleus*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dụ *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zaeae*, *Dichrocrocis* spp., *Diadisa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., ví dụ *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dụ *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta*

pusilla, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dụ *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., ví dụ *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., ví dụ *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ *Zabrus tenebrioides*;

thuộc bộ hai cánh (Diptera), ví dụ *Aedes* spp., ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., ví dụ *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., ví dụ *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., ví dụ *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., ví dụ *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., ví dụ *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilus casei*, *Prodiptosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví

dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*;

thuộc bộ cánh nửa (*Heteroptera*), ví dụ *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., ví dụ *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., ví dụ *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa* spp., *Leptocorisa varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., ví dụ *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., ví dụ *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., ví dụ *Nezara viridula*, *Oebalus* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., ví dụ *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

thuộc bộ cánh đều (*Homoptera*), ví dụ *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederarum*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., ví dụ *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*,

Chionaspis tegalensis, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*,
Chrysomphalus ficus, *Cicadulina mbila*, *Coccoxylus halli*, *Coccus* spp., ví dụ *Coccus hesperidum*,
Coccus longulus, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*,
Cryptoneossa spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes citri*,
Diaphorina citri, *Diaspis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., ví dụ *Dysaphis*
apiifolia, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp.,
ví dụ *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*,
Empoasca stenseni, *Eriosoma* spp., ví dụ *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*,
Eriosoma pyricola, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp.,
Euscelis bilobatus, *Ferrisia* spp., *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*,
Heteropsylla spinulosa, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus*
pruni, *Icerya* spp., ví dụ *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp.,
Laodelphax striatellus, *Lecanium* spp., ví dụ *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*),
Lepidosaphes spp., ví dụ *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp.,
ví dụ *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles*
facifrons, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium*
dirhodum, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., ví dụ *Myzus*
ascalonicus, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus*
nicotianae, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., ví dụ *Nephotettix cincticeps*,
Nephotettix nigropictus, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*,
Oxya chinensis, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., ví dụ
Paratrioza cockerelli, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., ví dụ *Pemphigus bursarius*,
Pemphigus populivora, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., ví dụ *Phenacoccus*
madeirensis, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., ví dụ
Phylloxera devastatrix, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp.,
ví dụ *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyrifolia*,
Pseudaulacaspis pentagona, *Pseudococcus* spp., ví dụ *Pseudococcus calceolariae*,
Pseudococcus comstocki, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*,
Pseudococcus viburni, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., ví dụ *Psylla buxi*, *Psylla mali*,
Psylla pyri, *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., ví dụ
Quadraspidotus juglansregiae, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus*

perniciosus, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., ví dụ *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., ví dụ *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., ví dụ *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., ví dụ *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

thuộc bộ cánh màng (Hymenoptera), ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., ví dụ *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Urocetus* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Xeris* spp.;

thuộc bộ chân đều (Isopoda), ví dụ *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

thuộc bộ cánh đều (Isoptera), ví dụ *Coptotermes* spp., ví dụ *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Microtermes obesi*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., ví dụ *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

thuộc bộ cánh vẩy (Lepidoptera), ví dụ *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., ví dụ *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., ví dụ *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., ví dụ *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., ví dụ *Anticarsia gemmatilis*, *Argyroproctis* spp., *Barathra brassicae*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca*

noctuides, *Diaphania* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*,
Elasmopalpus lignosellus, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., ví dụ *Ephestia elutella*,
Ephestia kuehniella, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp.,
Eupoecilia ambiguella, *Euproctis* spp., ví dụ *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp.,
Feltia spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., ví dụ *Grapholita*
molesta, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., ví dụ *Helicoverpa*
armigera, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., ví dụ *Heliothis virescens*, *Hofmannophila*
pseudospretella, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria*
flavofasciata, *Laphygma* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., ví dụ
Leucoptera coffeella, *Lithocolletis* spp., ví dụ *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane*
antennata, *Lobesia* spp., ví dụ *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp.,
ví dụ *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., ví dụ *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*,
Maruca testulalis, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*,
Mythimna separata, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp.,
Orthaga spp., *Ostrinia* spp., ví dụ *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema*
oryzae, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., ví dụ *Pectinophora*
gossypiella, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., ví dụ *Phthorimaea operculella*,
Phyllocnistis citrella, *Phyllonorycter* spp., ví dụ *Phyllonorycter blancardella*,
Phyllonorycter crataegella, *Pieris* spp., ví dụ *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia*
interpunctella, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp.,
Prodenia spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., ví dụ *Pseudaletia unipuncta*,
Pseudoplusia bao gồm, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., ví dụ
Schoenobius bipunctifer, *Scirpophaga* spp., ví dụ *Scirpophaga innotata*, *Scotia*
segetum, *Sesamia* spp., ví dụ *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., ví
dụ *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera*
praeifica, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia*
solanivora, *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola*
bisselliella, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ *Trichoplusia*
ni, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

thuộc bộ cánh thẳng (*Orthoptera* hoặc *Saltatoria*), ví dụ *Acheta domesticus*,
Dichroplus spp., *Gryllotalpa* spp., ví dụ *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp.,

Locusta spp., ví dụ *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., ví dụ *Melanoplus devastator*, *Schistocerca gregaria*;

thuộc bộ chấy (*Phthiraptera*), ví dụ *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

thuộc bộ rệp, sáp, mọt (*Psocoptera*), ví dụ *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

thuộc bộ cánh ống (*Siphonaptera*), ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., ví dụ *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

thuộc bộ đuôi tơ (*Thysanoptera*), ví dụ *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., ví dụ *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., ví dụ *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

thuộc bộ ba đuôi (*Zygentoma*) (= *Thysanura*), ví dụ *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

thuộc lớp rết tơ (*Symphyla*), ví dụ *Scutigera* spp., ví dụ *Scutigera immaculata*;

sinh vật gây hại thuộc ngành thân mềm (*Mollusca*), ví dụ thuộc lớp hai mảnh vỏ (*Bivalvia*), ví dụ *Dreissena* spp.,

và cũng thuộc lớp chân bụng (*Gastropoda*), ví dụ *Arion* spp., ví dụ *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., ví dụ *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

động vật ký sinh thuộc ngành giun dẹp và giun tròn (*Plathelminthes* và *Nematoda*), ví dụ *Ancylostoma* spp., ví dụ *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*,

Nematodirus spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;

sinh vật gây hại thực vật thuộc ngành giun tròn (*Nematoda*), tức là, giun tròn ký sinh trên thực vật, nhất là *Aglenchus* spp., ví dụ *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., ví dụ *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., ví dụ *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., ví dụ *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., ví dụ *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., ví dụ *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., ví dụ *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., ví dụ *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., ví dụ *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., ví dụ *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., ví dụ *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., ví dụ *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., ví dụ *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., ví dụ *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., ví dụ *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., ví dụ *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., ví dụ *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., ví dụ *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., ví dụ *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., ví dụ *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., ví dụ *Xiphinema index*.

Ngoài ra, từ phân giới của động vật nguyên sinh (động vật nguyên sinh), có thể

phòng trừ bộ rệp sáp (*Coccidia*), ví dụ, *Eimeria spp.*

Hợp chất có công thức (I), ở nồng độ hoặc tỷ lệ áp dụng nhất định, tùy ý cũng có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc các chất để cải thiện đặc tính của thực vật, làm chất diệt vi sinh vật hoặc chất diệt giao tử, ví dụ làm chất diệt nấm, chất chống nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt virus (bao gồm cả các chất chống viroít) hoặc làm chất chống sinh vật giống mycoplasma (MLO - mycoplasma-like organisms) và sinh vật giống rickettsia (RLO - rickettsia-like organisms). Nếu thích hợp, các hợp chất nêu trên cũng có thể được sử dụng làm hợp chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các hoạt chất khác.

Sáng chế còn đề cập đến công thức phối chế và các dạng sử dụng từ công thức phối chế này làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ các dung dịch ngâm, nhúng và phun, chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I). Trong một số trường hợp, các dạng sử dụng bao gồm thêm chất diệt sinh vật gây hại và/hoặc chất phụ gia để cải thiện sự hoạt động, như chất thấm, ví dụ, dầu thực vật, ví dụ dầu cải dầu, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ dầu parafin, alkyl este của axit béo thực vật, ví dụ methyl este của dầu cải dầu hoặc methyl este của dầu đậu nành hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất loang, ví dụ alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ amoni sulphat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng duy trì, ví dụ các polyme guar của dioctyl sulphosuxinat hoặc hydroxypropyl và/hoặc chất hút ẩm, ví dụ glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

Các công thức phối chế thông thường là, ví dụ, dạng chất lỏng hòa tan trong nước (SL), nhũ tương cô đặc (EC), nhũ tương trong nước (EW), huyền phù cô đặc (SC, SE, FS, OD), dạng hạt phân tán trong nước (WG), dạng hạt (GR) và dạng cô đóng nang (CS); các kiểu công thức phối chế này và kiểu công thức phối chế có thể khác được mô tả, ví dụ, trong tài liệu Crop Life International và trong tài liệu Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Các công thức phối chế, ngoài một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I), còn tùy ý bao

gồm thêm các hoạt chất hóa nông.

Các công thức phối chế này hoặc dạng sử dụng của chúng bao gồm chất bổ trợ, ví dụ chất độn, dung môi, chất tăng cường khả năng tự phát, chất mang, chất nhũ hóa, chất phân tán, chất bảo vệ chống sương giá, chất diệt sinh vật, chất cô đặc và/hoặc các chất bổ trợ khác, ví dụ chất phụ gia. Chất phụ gia trong bối cảnh này là thành phần làm tăng cường tác dụng sinh học của công thức phối chế, nhưng bản thân thành phần này không có bất kỳ tác dụng sinh học nào. Ví dụ về chất phụ gia đó là các chất tăng cường sự duy trì, lan rộng, bám dính lên bề mặt lá hoặc tăng cường tính thấm.

Các công thức phối chế này được tạo ra theo phương thức đã biết, ví dụ bằng cách trộn kết hợp hợp chất có công thức (I) với chất bổ trợ, ví dụ chất độn, dung môi và/hoặc chất mang rắn và/hoặc chất bổ trợ khác, ví dụ chất hoạt diện. Các công thức phối chế được tạo ra trong các cơ sở thích hợp hoặc nơi khác trước hoặc trong quá trình áp dụng.

Chất bổ trợ được sử dụng có thể là các chất thích hợp để truyền các đặc tính riêng biệt, như các đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học cụ thể, cho công thức phối chế của hợp chất có công thức (I), hoặc cho các dạng sử dụng được điều chế từ công thức phối chế này (ví dụ, các chất diệt sinh vật gây hại sẵn sàng để sử dụng như dung dịch phun hoặc các sản phẩm phủ ngoài hạt).

Các chất độn thích hợp, ví dụ là nước, các dung dịch hóa chất hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ các loại hydrocacbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), các rượu và polyol (các loại này tùy ý cũng có thể được thể, este hóa và/hoặc este hóa), các xeton (như axeton, xyclohexanon), các este (bao gồm các chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton được thể và không được thể, các sulphon và sulphoxit (như dimetyl sulphoxit).

Nếu chất độn được sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, các dung môi hữu cơ làm trợ dung môi. Các dung môi lỏng hữu dụng tốt hơn là: các dung môi thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, dung môi thơm clo hóa hoặc các hydrocacbon béo clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan hoặc parafin, ví dụ các phân đoạn dầu khoáng, dầu khoáng và dầu thực

vật, các rượu như butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, các xeton như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit và dimetyl sulphoxit, và cả nước.

Về mặt nguyên lý, có thể sử dụng tất cả các dung môi thích hợp. Ví dụ về dung môi thích hợp là hydrocacbon thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, hydrocacbon thơm hoặc béo clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan, parafin, các phân đoạn dầu khoáng, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu như metanol, etanol, isopropanol, butanol hoặc glycol và ete và este của chúng, xeton như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetyl sulphoxit, và nước.

Về mặt nguyên lý, có thể sử dụng tất cả các chất mang thích hợp. Chất mang hữu dụng cơ bản bao gồm: ví dụ muối amoni và chất khoáng tự nhiên nghiền nhỏ như kaolin, đất sét, bột talc, đá phấn, thạch anh, attapulgit, monmorilonit hoặc diatomit và chất khoáng tổng hợp nghiền nhỏ như silic dioxit nghiền mịn, alumin và silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, nhựa, sáp và/hoặc phân bón rắn. Hỗn hợp các chất mang có thể được sử dụng tương tự. Chất mang hữu dụng cho hạt bao gồm: ví dụ đá tự nhiên nghiền và phân mảnh như canxit, đá hoa, đá bột, sepiolit, dolomit và hạt tổng hợp từ vật liệu vô cơ và hữu cơ, và cả hạt từ vật liệu hữu cơ như mùn cưa, giấy, vỏ dừa, lõi ngô và cuộng thuốc lá.

Các chất độn hoặc dung môi khí hóa lỏng cũng có thể được sử dụng. Chất độn hoặc chất mang đặc biệt thích hợp là chất mà ở dạng khí tại nhiệt độ môi trường và dưới áp suất khí quyển, ví dụ khí đẩy dạng sol khí, như halohydrocacbon và cả butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Ví dụ về chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc chất làm ẩm có các đặc tính phân ly hoặc không phân ly, hoặc hỗn hợp của các chất hoạt diện này, đó là muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulphonic, muối của axit phenolsulphonic hoặc axit naphtalensulphonic, chất đa trùng ngưng của etylen oxit với rượu béo hoặc với axit béo hoặc với amin béo, với phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), muối của este sulphosuxinic, dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), este phosphoric của rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, este axit béo của

polyol, và dẫn xuất của hợp chất chứa sulphat, sulphonat và phosphat, ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulphonat, alkyl sulphat, arylsulphonat, sản phẩm thủy phân protein, dịch thải lignosulphit, và metyl xenluloza. Sự có mặt của chất hoạt diện là thuận lợi nếu như một trong số các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một trong số các chất mang trợ không hòa tan được trong nước và khi việc áp dụng diễn ra trong nước.

Các chất bổ trợ khác mà có thể có mặt trong công thức phối chế và dạng sử dụng dẫn xuất từ công thức phối chế này bao gồm chất màu như chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và xanh Prussian, và chất màu hữu cơ như chất màu alizarin, chất màu azo và chất màu kim loại phtaloxyanin, và các chất dinh dưỡng và các chất vi dinh dưỡng như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molybden và kẽm.

Các thành phần bổ sung có thể là chất ổn định, như chất ổn định nhiệt độ thấp, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng, hoặc các chất khác giúp cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý. Các chất tạo bọt hoặc chất chống tạo bọt cũng có thể có mặt.

Ngoài ra, công thức phối chế và dạng sử dụng thu được từ chúng đó cũng có thể chứa, làm chất bổ trợ bổ sung, chất kết dính như cacboxymetyl xenluloza và polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc nhựa, như gôm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, hoặc ngoài ra cả phospholipit tự nhiên như xephalin và lexithin và phospholipit tổng hợp. Các chất bổ trợ có thể khác là dầu khoáng và dầu thực vật.

Một cách tùy ý, các chất bổ trợ khác có thể có mặt trong công thức phối chế và dạng sử dụng thu được từ chúng. Ví dụ về chất phụ gia như vậy bao gồm chất tạo hương, chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất dính kết, chất cô đặc, chất sol-gel thuận nghịch, chất thấm, chất tăng cường khả năng duy trì, chất ổn định, chất chelat hóa, chất tạo phức, chất hút ẩm, chất loang. Nói chung, hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với chất phụ gia đặc hoặc lỏng bất kỳ thường được sử dụng cho các mục đích phối chế.

Chất tăng cường khả năng duy trì hữu dụng bao gồm tất cả các chất mà làm giảm sức căng bề mặt động lực, ví dụ dioctyl sulphosuxinat, hoặc làm tăng độ nhớt đàn hồi, ví dụ các polyme hydroxypropylguar.

Chất thấm hữu dụng trong bối cảnh sáng chế này là tất cả các chất mà điển hình được sử dụng để cải thiện tính thấm của hoạt chất hóa nông vào trong thực vật. Chất thấm được xác định trong bối cảnh này bằng khả năng thấm của chúng từ chất lỏng áp dụng (thường ở dạng nước) và/hoặc từ lớp phun phủ vào trong biểu bì của thực vật và bằng cách đó làm tăng khả năng di chuyển của hoạt chất trong biểu bì. Phương pháp mô tả trong tài liệu (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác định đặc tính này. Các ví dụ bao gồm rượu alkoxylat như etoxylat béo của dừa (10) hoặc isotridexyl etoxylat (12), este axit béo, ví dụ metyl este dầu cải dầu hoặc metyl este dầu đậu nành, alkoxylat amin béo, ví dụ tallowamin etoxylat (15), hoặc muối amoni và/hoặc phosphoni, ví dụ amoni sulphat hoặc diamoni hydrophosphat.

Công thức phối chế tốt hơn chứa từ 0,00000001% đến 98% theo khối lượng của hợp chất có công thức (I), tốt hơn nữa chứa từ 0,01% đến 95% theo khối lượng của hợp chất có công thức (I), tốt nhất chứa từ 0,5% đến 90% theo khối lượng của hợp chất có công thức (I), dựa vào khối lượng của công thức phối chế.

Hàm lượng hợp chất có công thức (I) trong các dạng sử dụng được điều chế từ công thức phối chế (nhất là chất diệt sinh vật gây hại) có thể thay đổi trong phạm vi rộng. Nồng độ của hợp chất có công thức (I) trong các dạng sử dụng điển hình có thể nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 95% theo khối lượng của hợp chất có công thức (I), tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,00001% đến 1% theo khối lượng, dựa vào khối lượng của dạng sử dụng. Việc áp dụng được hoàn thành theo cách thông thường thích hợp với dạng sử dụng.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp cùng với một hoặc nhiều chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt động vật thân mềm, chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, chất diệt vi sinh vật, các sinh vật có lợi, chất diệt cỏ, phân bón, chất xua đuổi chim, chất bổ dưỡng thực vật, chất tiết trùng, chất an toàn, chất truyền tín hiệu và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật thích hợp, bằng cách đó, ví dụ, để mở rộng phổ tác động, để kéo dài thời gian tác động, để gia tăng tỷ lệ tác động, để ngăn chặn sự đẩy ngược hoặc ngăn chặn sự phát triển tính kháng. Ngoài ra, các hỗn hợp hoạt chất thuộc loại này có thể giúp cải thiện sự phát triển của thực vật và/hoặc khả năng chịu các yếu tố phi sinh học, ví dụ nhiệt độ cao

hoặc thấp, khả năng chịu được hạn hán hoặc chịu được hàm lượng nước tăng cao hoặc độ mặn của đất. Cũng có thể cải thiện đặc tính trổ hoa và kết trái, tối ưu hóa khả năng nảy mầm và phát triển rễ, tạo thuận lợi cho việc thu hoạch và cải thiện năng suất, tác động lên quá trình chín, cải thiện chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của các sản phẩm thu hoạch, kéo dài thời gian bảo quản và/hoặc cải thiện khả năng xử lý của các sản phẩm thu hoạch.

Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể có mặt ở dạng hỗn hợp cùng với các hoạt chất khác hoặc chất truyền tín hiệu như chất hấp dẫn và/hoặc chất xua đuổi chim và/hoặc chất kích hoạt thực vật và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng và/hoặc phân bón. Tương tự, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp cùng với các chất để cải thiện các đặc tính của thực vật, ví dụ đặc tính sinh trưởng, năng suất và chất lượng của nguyên liệu thu hoạch.

Theo một phương án cụ thể của sáng chế, hợp chất có công thức (I) là ở dạng công thức phối chế hoặc các dạng sử dụng điều chế từ công thức phối chế này trong hỗn hợp cùng với các hợp chất khác, tốt hơn là các hợp chất như mô tả dưới đây.

Nếu như một trong các hợp chất nêu dưới đây có thể xuất hiện ở các dạng hỗn biến khác nhau, thì các dạng này cũng được bao gồm, thậm chí ngay cả không được nêu một cách rõ ràng trong mỗi trường hợp.

Chất diệt côn trùng/chất diệt ve bét/chất diệt giun tròn

Các hoạt chất xác định rõ ở đây bằng "tên chung" của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ trong tài liệu The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012, hoặc có thể được tìm thấy trên Internet (ví dụ, trang web với địa chỉ <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- (1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ cacbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các phosphat hữu cơ, ví dụ acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl,

cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

- (2) Các chất đối kháng kênh clorua qua cổng GABA, ví dụ xyclodiene-organoclos, ví dụ chlordane và endosulfan hoặc phenylpyrazols (fiproles), ví dụ ethiprole và fipronil.
- (3) Các chất điều biến kênh natri/các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ pyrethroids, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin s-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin [đồng phân (1R)-trans], deltamethrin, empenethrin [đồng phân (EZ)-(1R)], esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, permethrin, phenothrin [đồng phân (1R)-trans], prallethrin, pyrethrins (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [đồng phân (1R)], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxychlor.
- (4) Các chất chủ vận thụ thể axetylcholine nicotineric (nAChR), ví dụ neonicotinoids, ví dụ acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam hoặc nicotine hoặc sulfoxaflor.
- (5) Các chất kích hoạt dị lập thể của thụ thể axetylcholine nicotineric (nAChR), ví dụ

spinosyns, ví dụ spinetoram và spinosad.

- (6) Các chất kích hoạt kênh clorua, ví dụ, avermectins/milbemycins, ví dụ abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.
- (7) Các chất bắt chước hormone ấu trùng, ví dụ, các chất tương tự hormone ấu trùng, ví dụ hydroprene, kinoprene và methoprene hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.
- (8) Các hoạt chất với cơ chế tác động chưa biết hoặc không đặc hiệu, ví dụ các alkyl halogenua, ví dụ, metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc clopicrine hoặc sulphuryl florua hoặc thuốc gây nôn borax hoặc tartar.
- (9) Các chất chống hấp thụ chọn lọc, ví dụ pymetrozine hoặc flonicamid.
- (10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét, ví dụ clofentezine, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.
- (11) Các chất phá vỡ vi sinh vật ở màng ruột côn trùng, ví dụ *Bacillus thuringiensis* loài phụ israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ aizawai, *Bacillus thuringiensis* loài phụ kurstaki, *Bacillus thuringiensis* loài phụ tenebrionis, và các protein thực vật BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- (12) Các chất ức chế quá trình phosphoryl hóa oxy hóa, các chất phá hủy ATP, ví dụ diafenthiuron hoặc các hợp chất hữu cơ - thiếc, ví dụ azoxyclofen, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargite hoặc tetradifon.
- (13) Các chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa làm gián đoạn quá trình gradient H proton, ví dụ chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.
- (14) Các chất đối kháng thụ thể axetylcholine nicotinic, ví dụ bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.
- (15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 0, ví dụ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.
- (16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 1, ví dụ buprofezin.
- (17) Các chất ức chế quá trình lột xác (nhất là đối với Diptera, tức là, dipterans), ví dụ

cyromazin.

- (18) Các chất chủ vận thụ thể hocmon lột xác, ví dụ chromafenozide, halofenozide, metoxyfenozide và tebufenozide.
- (19) Các chất chủ vận octopaminergic, ví dụ amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-III, ví dụ hydrametylnon; hoặc acequinocyl; hoặc fluacrypyrim.
- (21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức - I, ví dụ từ nhóm của các chất diệt ve bét METI, ví dụ, fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenone (Derris).
- (22) Các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ indoxacarb hoặc metaflumizone.
- (23) Các chất ức chế men axetyl-CoA cacboxylaza, ví dụ tetronic và các dẫn xuất axit tetramic, ví dụ spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.
- (24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-IV, ví dụ phosphin, ví dụ nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua hoặc xyanua.
- (25) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-II, ví dụ xyenopyrafen và xyflumetofen.
- (28) Các chất tác động lên thụ thể ryanodin, ví dụ diamit, ví dụ chlorantraniliprole, xyantraniliprole và flubendiamit,

các hoạt chất khác, ví dụ afidopyropen, azadirachtin, benclothiaz, benzoximate, bifenazate, bromopropylate, chinomethionat, cryolite,

dicofol, diflovidazin, fluensulfone, flometoquin, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprole, fluopyram, flupyradifurone, fufenozide, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodione, meperfluthrin, paichongding, pyflubumide, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, tetrametylfluthrin và iodometan; và cả các chế phẩm dựa vào *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và cả các hợp chất sau: 3-bromo-N-{2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)cacbamoyl]phenyl}-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-cacboxamit (đã biết trong tài liệu WO2005/077934) và 1-{2-flo-4-metyl-5-

[(2,2,2-trifloetyl)sulphinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã biết trong tài liệu WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (đã biết trong tài liệu WO2003/106457), 2-clo-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (đã biết trong tài liệu WO2006/003494), 3-(2,5-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết trong tài liệu WO2009/049851), 3-(2,5-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-etylcarbonat (đã biết trong tài liệu WO2009/049851), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpyrrolidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết trong tài liệu WO2004/099160), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3-clophenyl)pyrimidin (đã biết trong tài liệu WO2003/076415), PF1364 (đăng ký CAS số 1204776-60-2), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-5-(triflometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifloetyl)amino]etyl}benzamid (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), 4-{5-[3-clo-5-(triflometyl)phenyl]-5-(triflometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifloetyl)amino]etyl}-1-naphtamid (đã biết trong tài liệu WO2009/002809), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-clo-3-metylbenzoyl]-2-metylhydrazincacboxylat (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-xyano-3-metylbenzoyl]-2-etylhydrazincacboxylat (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-xyano-3-metylbenzoyl]-2-metylhydrazincacboxylat (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), metyl 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)benzoyl]-2-etylhydrazincacboxylat (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), 1-(3-clopyridin-2-yl)-N-[4-xyano-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)phenyl]-3-{[5-(triflometyl)-2H-tetrazol-2-yl]metyl}-1H-pyrazol-5-cacboxamid (đã biết trong tài liệu WO2010/069502), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-cacboxamid (đã biết trong tài liệu CN102057925), 3-clo-N-(2-xyanopropan-2-yl)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptaflopropan-2-yl)-2-metylphenyl]phtalamit (đã biết trong tài liệu WO2012/034472), 8-clo-N-[(2-clo-5-metoxi)phenyl]sulphonyl]-6-(triflometyl)imidazo[1,2-a]pyridin-2-cacboxamid (đã biết trong tài liệu WO2010/129500), 4-[5-(3,5-

diclophenyl)-5-(triflometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxidothietan-3-yl)benzamid (đã biết trong tài liệu WO2009/080250), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-5-(triflometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxidothietan-3-yl)benzamid (đã biết trong tài liệu WO2012/029672), 1-[(2-clo-1,3-thiazol-5-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olat (đã biết trong tài liệu WO2009/099929), 1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-

pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olat (đã biết trong tài liệu WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahydro-1H-5,8-epoxyimidazo[1,2-a]azepine (đã biết trong tài liệu WO2010/069266), (2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-N'-nitro-2-pentylidenhydrazincarboximidamid (đã biết trong tài liệu WO2010/060231), 4-(3-{2,6-diclo-4-[(3,3-dicloprop-2-en-1-yl)oxy]phenoxy}propoxy)-2-metoxi-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biết trong tài liệu CN101337940), N-[2-(tert-butylcacbamoyl)-4-clo-6-metylphenyl]-1-(3-clopyridin-2-yl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-cacboxamid (đã biết trong tài liệu WO2008/134969).

Các chất trừ nấm

Các hoạt chất xác định rõ ở đây bằng tên chung của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu "Pesticide Manual" hoặc trên mạng Internet (ví dụ tại địa chỉ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Các chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.1) aldimorph, (1.2) azaconazol, (1.3) bitertanol, (1.4) bromuconazol, (1.5) cyproconazol, (1.6) diclobutrazol, (1.7) difenoconazol, (1.8) diniconazol, (1.9) diniconazol-M, (1.10) dodemorph, (1.11) dodemorph axetat, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamid, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorph, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafole, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalil, (1.27) imazalil sulphat, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) myclobutanil, (1.32) naftifin, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoate, (1.37) penconazol, (1.38) piperalin, (1.39) prochloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) prothioconazol, (1.42) pyributicarb, (1.43) pyrifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) spiroxamine, (1.47)

tebuconazol, (1.48) terbinafin, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorph, (1.53) triflumizole, (1.54) triforine, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-P, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)xycloheptanol, (1.61) metyl 1-(2,2-dimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-cacboxylat, (1.62) N'-{5-(diflometyl)-2-metyl-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.63) N-etyl-N-metyl-N'-{2-metyl-5-(triflometyl)-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}imidoformamit và (1.64) O-[1-(4-metoxypheoxy)-3,3-dimetylbutan-2-yl]-1H-imidazol-1-cacbothioat, (1.65) pyrisoxazol.

(2) Các chất ức chế hô hấp (các chất ức chế chuỗi hô hấp), ví dụ (2.1) bixafen, (2.2) boscalid, (2.3) carboxin, (2.4) diflumentorim, (2.5) fenfuram, (2.6) fluopyram, (2.7) flutolanil, (2.8) fluxapyroxad, (2.9) furametpyr, (2.10) furmexyclox, (2.11) hỗn hợp isopyrazam của chất triệt quang epime hóa dạng đồng phân syn 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang epime hóa dạng đồng phân anti 1RS,4SR,9SR, (2.12) isopyrazam (chất triệt quang epime hóa dạng đồng phân anti), (2.13) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime hóa dạng đồng phân anti 1R,4S,9S), (2.14) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime hóa dạng đồng phân anti 1S,4R,9R), (2.15) isopyrazam (chất triệt quang epime hóa dạng đồng phân syn 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime hóa dạng đồng phân syn 1R,4S,9R), (2.17) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime hóa dạng đồng phân syn 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxycarboxin, (2.20) penflufen, (2.21) penthiopyrad, (2.22) sedaxane, (2.23) thifluzamide, (2.24) 1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.25) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.26) 3-(diflometyl)-N-[4-flo-2-(1,1,2,3,3,3-hexaflopropoxy)phenyl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.27) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxypentan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.28) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.29) benzovindiflupyr, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit và (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.32) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-

dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.33) 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.34) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.35) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.36) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.37) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.38) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.39) 1,3,5-trimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.40) 1,3,5-trimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (2.41) benodanil, (2.42) 2-clo-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-cacboxamit, (2.43) isofetamid

(3) Các chất ức chế hô hấp (các chất ức chế chuỗi hô hấp) mà tác động lên phức III của chuỗi hô hấp, ví dụ (3.1) ametoctradin, (3.2) amisulbrom, (3.3) azoxystrobin, (3.4) xyazofamid, (3.5) coumetoxystrobin, (3.6) coumoxystrobin, (3.5) dimoxystrobin, (3.8) enestroburin, (3.9) famoxadone, (3.10) fenamidone, (3.11) flufenoxystrobin, (3.12) fluoxastrobin, (3.13) kresoxim-metyl, (3.14) metominostrobin, (3.15) orysastrobin, (3.16) picoxystrobin, (3.17) pyraclostrobin, (3.18) pyrametostrobin, (3.19) pyraoxystrobin, (3.20) pyribencarb, (3.21) triclopyricarb, (3.22) trifloxystrobin, (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-clo-2-metylphenoxy)-5-flopyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.24) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-(2-{[(((1E)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden}amino)oxy)metyl]phenyl}etanamit, (3.25) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-{2-[(E)-({1-[3-(triflometyl)phenyl]etoxy}imino)metyl]phenyl}etanamit, (3.26) (2E)-2-{2-[({(1E)-1-(3-{[(E)-1-flo-2-phenylethenyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.27) (2E)-2-{2-[({(2E,3E)-4-(2,6-diclophenyl)but-3-en-2-yliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metyletanamit, (3.28) 2-clo-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-cacboxamit, (3.29) 5-metoxi-2-metyl-4-(2-{[(((1E)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden}amino)oxy)metyl]phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, (3.30) metyl (2E)-2-{2-[(xyclopropyl[(4-metoxiphenyl)imino]metyl]sulphanyl)metyl]phenyl}-3-

metoxyprop-2-enoat, (3.31) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-(formylamino)-2-hydroxybenzamid, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamid, (4) các chất ức chế phân bào nguyên phân và sự phân chia tế bào, ví dụ (4.1) benomyl, (4.2) carbendazim, (4.3) chlorfenazol, (4.4) diethofencarb, (4.5) ethaboxam, (4.6) fluopicolid, (4.7) fuberidazol, (4.8) pencycuron, (4.9) thiabendazol, (4.10) thiophanate-metyl, (4.11) thiophanate, (4.12) zoxamide, (4.13) 5-clo-7-(4-metylpipeidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin và (4.14) 3-clo-5-(6-clopyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflophenyl)pyridazin.

(5) Các hợp chất có hoạt tính trên nhiều vị trí, ví dụ (5.1) hỗn hợp Bordeaux, (5.2) captafol, (5.3) captan, (5.4) clothalonil, (5.5) các chế phẩm chứa đồng như đồng hydroxit, (5.6) đồng naphtenat, (5.7) đồng oxit, (5.8) đồng oxyclorea, (5.9) đồng sulphat, (5.10) diclofluanid, (5.11) dithianon, (5.12) dodine, (5.13) kiềm không chứa dodine, (5.14) ferbam, (5.15) fluorfolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatine, (5.18) guazatine axetat, (5.19) iminoctadine, (5.20) iminoctadine albesilate, (5.21) iminoctadine triaxetat, (5.22) mancopper, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) kẽm metiram, (5.27) đồng-oxine, (5.28) propamidin, (5.29) propineb, (5.30) lưu huỳnh và các chế phẩm chứa lưu huỳnh, ví dụ canxi polysulphide, (5.31) thiram, (5.32) tolylfluanid, (5.33) zineb, (5.34) ziram và (5.35) anilazin.

(6) Các chất kích thích tính kháng, ví dụ (6.1) acibenzolar-S-metyl, (6.2) isotianil, (6.3) probenazol, (6.4) tiadinil và (6.5) laminarin.

(7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và protein, ví dụ (7.1), (7.2) blasticidin-S, (7.3) cyprodinil, (7.4) kasugamycin, (7.5) kasugamycin hydroclorua hydrate, (7.6) mepanipyrim, (7.7) pyrimethanil, (7.8) 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin và (7.9) oxytetracycline và (7.10) streptomycin.

(8) Các chất ức chế sản xuất ATP, ví dụ (8.1) fentin axetat, (8.2) fentin clorua, (8.3) fentin hydroxit và (8.4) silthiofam.

(9) Các chất ức chế tổng hợp vách tế bào, ví dụ (9.1) benthiavalicarb, (9.2) dimethomorph, (9.3) flumorph, (9.4) iprovalicarb, (9.5) mandipropamid, (9.6) polyoxins, (9.7) polyoxorim, (9.8) validamycin A, (9.9) valifenalate và (9.10) polyoxin B.

(10) Các chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.1) biphenyl, (10.2) chlorneb, (10.3) dicloran, (10.4) edifenphos, (10.5) etridiazol, (10.6) iodocarb, (10.7) iprobenfos, (10.8) isoprothiolane, (10.9) propamocarb, (10.10) propamocarb hydroclorua, (10.11) prothiocarb, (10.12) pyrazophos, (10.13) quintozone, (10.14) tecnazene và (10.15) tolclofos-metyl.

(11) Các chất ức chế sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.1) carpropamid, (11.2) diclocymet, (11.3) fenoxanil, (11.4) fthalide, (11.5) pyroquilon, (11.6) tricyclazol và (11.7) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}cacbamat.

(12) Các chất ức chế tổng hợp axit nucleic, ví dụ (12.1) benalaxyl, (12.2) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.3) bupirimate, (12.4) clozylacon, (12.5) dimethirimol, (12.6) ethirimol, (12.7) furalaxyl, (12.8) hymexazol, (12.9) metalaxyl, (12.10) metalaxyl-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixyl, (12.13) axit oxolinic và (12.14) oethilinone.

(13) Các chất ức chế truyền tín hiệu, ví dụ (13.1) chlozolate, (13.2) fenpiclonil, (13.3) fludioxonil, (13.4) iprodione, (13.5) procymidone, (13.6) quinoxifen, (13.7) vinclozolin và (13.8) proquinazid.

(14) Các chất phân tách, ví dụ (14.1) binapacryl, (14.2) dinocap, (14.3) ferimzone, (14.4) fluazinam và (14.5) meptyldinocap.

(15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.1) benthiazol, (15.2) bethoxazin, (15.3) capsimycin, (15.4) carvone, (15.5) chinomethionat, (15.6) pyriofenone (chlazafenone), (15.7) cufraneb, (15.8) xyflufenamid, (15.9) cymoxanil, (15.10) cyprosulfamide, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) diclophen, (15.14) diclomezine, (15.15) difenzoquat, (15.16) difenzoquat metylsulphat, (15.17) diphenylamin, (15.18) EcoMate, (15.19) fenpyrazamine, (15.20) flumetover, (15.21) fluorimid, (15.22) flusulfamide, (15.23) flutianil, (15.24) fosetyl-nhôm, (15.25) fosetyl-canxi, (15.26) fosetyl-natri, (15.27) hexaclobenzen, (15.28) irumamycin, (15.29) methasulfocarb, (15.30) metyl isothioxyanate, (15.31) metrafenone, (15.32) mildiomicin, (15.33) natamycin, (15.34) niken dimetyldithiocacbamat, (15.35) nitrothal-isopropyl, (15.36) oethilinone, (15.37) oxamocarb, (15.38) oxyfenthiin, (15.39) pentaclophenol và muối của nó, (15.40) phenothrin, (15.41) axit phosphoric và muối của nó, (15.42) propamocarb-fosetilate,

(15.43) propanosine-natri, (15.44) pyrimorph, (15.45) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (15.46) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (15.47) pyrolnitrin, (15.48) tebufloquin, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolnifanide, (15.51) triazoxide, (15.52) trichlamide, (15.53) zarilamid, (15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)methoxy]-4-metoxypyridin-2-yl)cacbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.58) 1-(4-metoxiphenoxy)-3,3-dimetylbutan-2-yl 1H-imidazol-1-cacboxylat, (15.59) 2,3,5,6-tetraclo-4-(metylsulphonyl)pyridin, (15.60) 2,3-dibutyl-6-clothieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-on, (15.61) 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrone, (15.62) 2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5R)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)etanon, (15.63) 2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5S)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)etanon, (15.64) 2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-{4-[4-(5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl)-1,3-thiazol-2-yl]piperidin-1-yl}etanon, (15.65) 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-on, (15.66) 2-clo-5-[2-clo-1-(2,6-diflo-4-metoxiphenyl)-4-metyl-1H-imidazol-5-yl]pyridin, (15.67) 2-phenylphenol và salts, (15.68) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.69) 3,4,5-triclopyridin-2,6-dicacbonitril, (15.70) 3-clo-5-(4-clophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-6-metylpyridazin, (15.71) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimetylpyridazin, (15.72) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.73) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen-2-sulphonohydrazide, (15.74) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.75) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.76) 5-metyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin, (15.77) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylate, (15.78) N'-(4-{[3-(4-clobenzyl)-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidofornamit, (15.79) N-(4-clobenzyl)-3-[3-metoxi-4-

(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamit, (15.80) N-[(4-clophenyl)(xyano)metyl]-3-[3-metoxo-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamit, (15.81) N-[(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)metyl]-2,4-diclonicotinamit, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)etyl]-2,4-diclonicotinamit, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)etyl]-2-flo-4-iodonicotinamit, (15.84) N-{(E)-[(xyclopropylmetoxo)imino][6-(diflometoxo)-2,3-diflophenyl]metyl}-2-phenylaxetamit, (15.85) N-{(Z)-[(xyclopropylmetoxo)imino][6-(diflometoxo)-2,3-diflophenyl]metyl}-2-phenylaxetamit, (15.86) N'-{4-[(3-tert-butyl-4-xyano-1,2-thiazol-5-yl)oxy]-2-clo-5-metylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoforamit, (15.87) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,3-thiazol-4-cacboxamit, (15.88) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-cacboxamit, (15.89) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-1,3-thiazol-4-cacboxamit, (15.90) pentyl {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}cacbamat, (15.91) axit phenazin-1-cacboxylic, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) quinolin-8-ol sulphat (2:1), (15.94) tert-butyl {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}cacbamat, (15.95) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.96) N-(4'-clobiphenyl-2-yl)-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.97) N-(2',4'-diclobiphenyl-2-yl)-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.98) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[4'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.99) N-(2',5'-diflobiphenyl-2-yl)-1-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.100) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.101) 5-flo-1,3-dimetyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.102) 2-clo-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.103) 3-(diflometyl)-N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-5-flo-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.105) 3-(diflometyl)-N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.106) N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)-5-flo-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.107) 2-clo-N-(4'-etynylbiphenyl-2-yl)nicotinamit, (15.108) 2-clo-N-[4'-(3,3-dimetylbut-1-yn-1-

yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.109) 4-(diflometyl)-2-metyl-N-[4'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1,3-thiazol-5-cacboxamit, (15.110) 5-flo-N-[4'-(3-hydroxy-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.111) 2-clo-N-[4'-(3-hydroxy-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.112) 3-(diflometyl)-N-[4'-(3-metoxi-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.113) 5-flo-N-[4'-(3-metoxi-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.114) 2-clo-N-[4'-(3-metoxi-3-metylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamit, (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metylpyridin-3-yl)(2,3,4-trimetoxi-6-metylphenyl)metanon, (15.116) N-[2-(4-{[3-(4-clophenyl)prop-2-yn-1-yl]oxy}-3-metoxi-phenyl)etyl]-N2-(metylsulphonyl)valinamide, (15.117) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic, (15.118) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}cacbamat, (15.119) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng hồ biến: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.120) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.121) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.122) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.123) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamit, (15.124) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.125) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.127) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.128) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanate, (15.129) 5-(allylsulphanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.131) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.132) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.133) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanate, (15.134) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanate, (15.135) 5-(allylsulphanyl)-1-{[rel(2R,3S)-

3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(allylsulphanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (15.145) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamid, (15.146) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.147) 2-[6-(3-flo-4-metoxiphyenyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazolin, (15.148) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.149) axit abscisic, (15.150) 3-(diflometyl)-N-metoxi-1-metyl-N-[1-(2,4,6-triclophenyl)propan-2-yl]-1H-pyrazol-4-cacboxamid, (15.151) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.152) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.153) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.154) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.155) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.156) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.157) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamid, (15.158) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamid, (15.159) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-cacboxamid, (15.160) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-

methyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.161) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.162) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.163) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.164) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.165) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.166) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.167) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.168) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.169) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.170) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.171) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.172) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.173) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.174) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.175) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.176) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamide, (15.177) 3-(diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.178) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.179) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid, (15.180) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.181) N'-(4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamid, (15.182) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin. Tất cả các thành phần kết hợp nêu trong các nhóm từ (1) đến (15), trong trường hợp có thể, có thể tạo thành muối cùng với các kiềm hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như

vậy dựa trên cơ sở các nhóm chức của chúng.

Các chất diệt sinh vật gây hại sinh học làm thành phần kết hợp

Hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với các chất diệt sinh vật gây hại sinh học.

Các chất diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm chủ yếu là vi khuẩn, nấm, nấm men, chất chiết thực vật và các sản phẩm được tạo ra bởi vi sinh vật, bao gồm cả các protein và sản phẩm chuyển hóa thứ cấp.

Các chất diệt sinh vật gây hại sinh học bao gồm vi khuẩn như vi khuẩn sinh bào tử, vi khuẩn cư trú ở rễ và vi khuẩn mà hoạt động ở dạng chất diện côn trùng, chất diệt nấm hoặc chất diệt giun tròn sinh học.

Ví dụ về các vi khuẩn như vậy mà chúng được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học đó là:

Bacillus amyloliquefaciens, chủng FZB42 (DSM 231179), hoặc *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 hoặc *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (Mã truy cập số CNCM I-1582) hoặc *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng GB34 (Mã truy cập số ATCC 700814) và chủng QST2808 (Mã truy cập số NRRL B-30087), hoặc *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng GB03 (Mã truy cập số ATCC SD-1397), hoặc *Bacillus subtilis* chủng QST713 (Mã truy cập số NRRL B-21661) hoặc *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (Mã truy cập số NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (serotype H-14), chủng AM65-52 (Mã truy cập số ATCC 1276), hoặc *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là chủng ABTS-1857 (SD-1372), hoặc *B. thuringiensis subsp. kurstaki* chủng HD-1, hoặc *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* chủng NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Rotylenchulus reniformis nematode)-PR3 (Mã truy cập số ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (Mã truy cập số NRRL 30232).

Ví dụ về nấm và nấm men mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học là:

Beauveria bassiana, đặc biệt là chủng ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, đặc biệt

là chủng CON/M/91-8 (Mã truy cập số DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, đặc biệt là chủng HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*), đặc biệt là chủng KV01, *Metarhizium anisopliae*, đặc biệt là chủng F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, đặc biệt là chủng NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (hiện nay: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (Mã truy cập số ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* chủng 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, đặc biệt là chủng V117b, *Trichoderma atroviride*, đặc biệt là chủng SC1 (Mã truy cập số CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum rifai T39* (Mã truy cập số CNCM I-952).

Ví dụ về các virus mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học là:

Virus thể hạt (GV) *Adoxophyes orana* (bướm trái cây mùa hè), virus thể hạt (GV) *Cydia pomonella* (ấu trùng sâu bướm), virus đa diện nhân (NPV) *Helicoverpa armigera* (giun nang ở bông), *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (sâu xanh mùa thu) mNPV, *Spodoptera littoralis* (sâu ăn lá bông châu Phi) NPV.

Cũng được bao gồm là vi khuẩn và nấm mà được bổ sung làm 'chất đề cấy' lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc các cơ quan của thực vật và mà nhờ bởi các đặc tính đặc biệt của chúng, thúc đẩy sự phát triển của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ bao gồm:

Agrobacterium spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, đặc biệt là *Burkholderia cepacia* (trước đây được biết là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Chất an toàn làm thành phần kết hợp

Hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với chất an toàn, ví dụ

benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenchlorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphthalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoil)amino]phenyl}sulphonyl)benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả thực vật và các bộ phận của thực vật có thể được xử lý theo sáng chế. Thực vật được hiểu ở đây có nghĩa là toàn bộ thực vật và nhóm thực vật, như thực vật hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm cả cây trồng xuất hiện tự nhiên), ví dụ ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loài rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu, và cả thực vật lấy quả (với các loại quả táo, lê, các loại quả cam quýt và nho). Cây trồng có thể là thực vật mà có thể thu được bằng các phương pháp nhân giống và tối ưu hóa thông thường hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và phương pháp kỹ thuật gen hoặc bằng sự kết hợp của các phương pháp này, bao gồm cả thực vật chuyển đổi gen và bao gồm cả giống cây trồng có khả năng được bảo vệ hoặc không có khả năng được bảo vệ bởi quyền của người tạo giống cây trồng. Các bộ phận của thực vật sẽ được hiểu có nghĩa là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, hoa và rễ, ví dụ minh họa đó là các loại lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thể quả, quả và hạt và cả thân củ, rễ và thân rễ. Các bộ phận của thực vật cũng bao gồm cả nguyên liệu thu hoạch và nguyên liệu gây giống sinh sản và sinh dưỡng, ví dụ cành giâm, thân củ, thân rễ, cành ghép và hạt.

Việc xử lý thực vật và các bộ phận của thực vật theo sáng chế bằng hợp chất có công thức (I) được tiến hành trực tiếp hoặc bằng cách cho hợp chất nêu trên tác động lên không gian xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản của chúng bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách ngâm, phun, làm bay hơi, tạo mù, tung rắc, quét lên, tiêm và trong trường hợp nguyên liệu nhân giống, đặc biệt là đối với hạt giống, cả bằng cách phủ một hoặc nhiều lớp phủ.

Như đã nêu ở trên, theo sáng chế, có thể xử lý tất cả thực vật và bộ phận của thực vật. Theo một phương án ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và giống thực vật, hoặc các loại thu được bằng phương pháp gây giống sinh học thông thường, như lai giống hoặc dung hợp tế bào trần, và các bộ phận của thực vật nêu trên, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng được xử lý. Thuật ngữ “bộ phận” hoặc “bộ phận của thực vật” hoặc “bộ phận thực vật” đã được giải thích ở trên. Theo sáng chế, tốt hơn là xử lý thực vật thuộc các giống thông thường trên thị trường tương ứng hoặc các loài đang sử dụng. Các loài cây được hiểu theo nghĩa là các cây có đặc tính mới ("tính trạng") thu được bằng phương pháp gây giống truyền thống, gây đột biến hoặc các phương pháp khác với sự hỗ trợ của các phương pháp ADN tái kết hợp. Các loài này có thể là cây giống, giống, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

Thực vật chuyển gen, xử lý hạt và các dòng tích hợp

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen ưu tiên (các loài thu được bằng kỹ thuật di truyền) mà cần được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các thực vật mà, thông qua sự biến đổi gen, thu được vật liệu di truyền mà sẽ truyền các tính trạng hữu dụng đặc biệt có lợi cho các thực vật này. Ví dụ về các đặc tính này là sự sinh trưởng tốt hơn, khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp tăng lên, khả năng chịu đựng hạn hán hoặc các mức nước hoặc độ mặn của đất tốt hơn, hiệu suất ra hoa tăng lên, thu hoạch dễ hơn, nhanh chín hơn, năng suất cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng cao hơn của các sản phẩm được thu hoạch, thời gian bảo quản và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn. Các ví dụ khác và đặc biệt được nhấn mạnh về các đặc tính như vậy là tăng tính kháng của thực vật chống lại các động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại côn trùng, nhện, giun tròn, ve bét, ốc sên và ốc, ví dụ nhờ bởi các độc tố tạo ra trên thực vật, đặc biệt là các độc tố hình thành trên thực vật bằng vật liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, bởi các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả sự phối hợp của các gen này), và cũng tăng tính kháng của thực vật chống lại nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh trên thực vật, ví dụ gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc

tổ biểu hiện tương ứng, và cả tăng khả năng chống chịu của thực vật đối với một số hoạt chất diệt cỏ nhất định, ví dụ imidazolinone, sulphonylure, glyphosat hoặc phosphinothricin (ví dụ, gen "PAT"). Các gen truyền tính trạng mong muốn cũng có thể có mặt kết hợp với nhau trong thực vật chuyển gen. Ví dụ về thực vật chuyển gen bao gồm các cây trồng quan trọng, như ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu và cả thực vật lấy quả (với các loại quả táo, lê, các loại quả cam quýt và nho), đặc biệt ưu tiên có thể kể đến ngô, đậu tương, lúa mì, lúa, khoai tây, bông, mía đường, thuốc lá và cải dầu. Các tính trạng đặc biệt chú ý đó là tăng tính kháng của thực vật với côn trùng, lớp nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý

Việc xử lý thực vật và các bộ phận của thực vật bằng hợp chất có công thức (I) được tiến hành trực tiếp hoặc bằng cách tác động lên vùng không gian xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhúng, phun, phun mù, tưới, làm bay hơi, phun bụi, tạo sương, gieo rắc, tạo bột, quét lên, phết lên, tiêm, tưới nước (tưới ướt), tưới ngập và trong trường hợp nguyên liên nhân giống, đặc biệt là trong trường hợp hạt giống, bao gồm cả phương pháp xử lý hạt khô, xử lý hạt ướt, xử lý dạng huyền phù đặc, phủ lên vỏ ngoài, phủ bằng một hoặc nhiều lớp phủ, v.v.. Cũng có thể triển khai hợp chất có công thức (I) bằng phương pháp thể tích cực nhỏ hoặc bơm dạng sử dụng hoặc chính bản thân hợp chất có công thức (I) vào trong đất.

Việc xử lý thực vật trực tiếp được ưu tiên đó là áp dụng lên lá, có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) được áp dụng lên hệ lá, trong đó tần suất xử lý và tỷ lệ áp dụng cần được điều chỉnh theo mức độ nhiễm bởi sinh vật gây hại đích.

Trong trường hợp hợp chất tác động theo đường hệ thống, hợp chất có công thức (I) cũng được đưa vào trong thực vật thông qua hệ rễ. Sau đó, thực vật được xử lý thông qua sự tác động của hợp chất có công thức (I) lên môi trường sống của thực vật. Việc xử lý này có thể được hoàn thành, ví dụ, bằng cách tưới ướt, hoặc bằng cách kết hợp vào trong đất hoặc dung dịch chất dinh dưỡng, có nghĩa là, vị trí của thực vật (ví

dụ, các hệ trồng trong đất hoặc trong nước) được thấm bởi dạng dịch lỏng của hợp chất có công thức (I), hoặc bằng cách áp dụng lên đất, có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) được đưa ở dạng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong vị trí của thực vật. Trong trường hợp cây trồng là lúa, việc xử lý này cũng có thể được hoàn thành bằng cách định lượng hợp chất có công thức (I) ở dạng áp dụng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong cánh đồng lúa ngập nước.

Xử lý hạt

Việc phòng trừ động vật gây hại bằng cách xử lý hạt của thực vật đã biết từ lâu và là đối tượng cải tiến liên tục. Tuy nhiên, việc xử lý hạt dẫn đến hàng loạt vấn đề mà thường không thể giải quyết được một cách thỏa mãn. Do đó, tốt hơn là phát triển các phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm mà phương pháp này không cần hoặc ít nhất giảm thiểu đáng kể việc sử dụng thêm chất diệt sinh vật gây hại trong quá trình bảo quản, sau khi gieo hạt hoặc sau khi thực vật nảy mầm. Ngoài ra, tốt hơn cần tối ưu hóa lượng hoạt chất được sử dụng để tạo ra sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm tránh khỏi sự tấn công của các động vật gây hại, mà không gây tổn hại cho chính thực vật này bởi hoạt chất được sử dụng. Cụ thể, các phương pháp xử lý hạt cũng cần phải tính đến các đặc tính diệt côn trùng hoặc diệt giun tròn nội sinh của thực vật chuyển gen kháng hoặc chịu được sinh vật gây hại nhằm để đạt được sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm với lượng sản phẩm bảo vệ cây trồng tối thiểu.

Do đó, sáng chế cũng đề cập cụ thể hơn nữa đến phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm tránh khỏi sự tấn công của sinh vật gây hại, bằng cách xử lý hạt bằng một trong số các hợp chất có công thức (I). Phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm theo sáng chế chống lại sự tấn công của các sinh vật gây hại còn bao gồm phương pháp, trong đó hạt được xử lý đồng thời trong một thao tác hoặc tuần tự bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp. Sáng chế cũng bao gồm phương pháp, trong đó hạt được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp.

Bản mô tả bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để xử lý hạt để bảo vệ hạt và thực vật tạo ra tránh khỏi động vật gây hại.

Sáng chế còn đề cập đến hạt mà hạt này đã được xử lý bằng hợp chất có công

thức (I) để bảo vệ tránh khỏi động vật gây hại. Sáng chế cũng đề cập đến hạt mà hạt này đã được xử lý đồng thời bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp. Sáng chế còn đề cập đến hạt mà hạt này đã được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp. Trong trường hợp hạt mà hạt này đã được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp, các chất riêng biệt có thể có mặt trên hạt trong các lớp khác nhau. Trong trường hợp này, các lớp chứa hợp chất có công thức (I) và các thành phần kết hợp tùy ý có thể được tách riêng bằng lớp trung gian. Sáng chế cũng đề cập đến hạt, trong đó hợp chất có công thức (I) và thành phần kết hợp đã được áp dụng như một phần của lớp phủ hoặc làm một lớp khác hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ ra.

Sáng chế còn đề cập đến hạt mà, sau khi xử lý bằng hợp chất có công thức (I), được cho tiến hành xử lý phủ màng để ngăn chặn sự bào mòn bụi trên hạt.

Một trong các lợi thế xuất hiện khi một trong số các hợp chất có công thức (I) tác động theo đường hệ thống là ở chỗ, việc xử lý hạt không chỉ bảo vệ bản thân hạt, mà còn bảo vệ cả thực vật nảy sinh từ hạt, sau khi nảy mầm, tránh khỏi động vật gây hại. Theo phương thức này, việc xử lý trung gian cho cây trồng ở thời điểm gieo hạt hoặc sau đó một thời gian ngắn có thể được loại bỏ.

Lợi thế khác là ở chỗ, việc xử lý hạt bằng hợp chất có công thức (I) có thể tăng cường sự nảy mầm và sự phát triển của hạt đã xử lý.

Tương tự, cũng có thể được xem là lợi thế ở chỗ, hợp chất có công thức (I) đặc biệt còn có thể được sử dụng cho hạt chuyển gen.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng kết hợp với các thành phần thuộc công nghệ truyền tín hiệu, ví dụ, để dẫn đến sự tạo cụm tốt hơn bởi các hiện tượng cộng sinh, ví dụ chủng vi khuẩn nốt rễ, nấm cộng sinh mycorrhizae và/hoặc vi khuẩn hoặc nấm nội ký sinh thực vật và/hoặc dẫn đến sự cố định nitơ tối ưu.

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để bảo vệ hạt của giống thực vật bất kỳ được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong trồng rừng hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn nữa, hạt nêu trên bao gồm hạt của ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, kê và yến mạch), ngô, bông, đậu tương, lúa, khoai tây, hướng dương, cà

phê, thuốc lá, canola, cải dầu, củ cải đường (ví dụ, củ cải đường và củ cải đường trong chăn nuôi), đậu phộng, các loại rau (ví dụ, cà chua, dưa chuột, đậu, các loại rau họ cải, hành và rau diếp), thực vật lấy quả, cỏ và cây cảnh. Đặc biệt quan trọng là việc xử lý hạt của ngũ cốc (như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen và yến mạch), ngô, đậu tương, bông, canola, cải dầu và lúa.

Như đã nêu ở trên, việc xử lý hạt chuyển gen bằng hợp chất có công thức (I) cũng đặc biệt quan trọng. Đó là hạt của các cây mà thông thường chứa ít nhất một gen khác loại có tác dụng kiểm soát sự biểu hiện của polypeptit có các đặc tính diệt côn trùng và/hoặc diệt giun tròn cụ thể. Gen khác loại ở hạt chuyển gen có thể có nguồn gốc từ vi sinh vật như *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* hoặc *Gliocladium*. Sáng chế đặc biệt thích hợp để xử lý hạt chuyển gen chứa ít nhất một gen khác loại có nguồn gốc từ *Bacillus sp.*. Gen khác loại tốt hơn nữa có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*.

Trong bối cảnh theo sáng chế, hợp chất có công thức (I) được áp dụng lên hạt. Tốt hơn là, hạt được xử lý ở trạng thái, trong đó hạt ở mức ổn định đủ để không xuất hiện bất kỳ tổn hại nào trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ trong khoảng từ lúc thu hoạch đến khi gieo. Thường sử dụng hạt được tách ra khỏi thực vật và không chứa lõi, vỏ hạt, thân, vỏ, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt mà hạt này đã được thu hoạch, làm sạch và sấy khô tới hàm lượng ẩm cho phép để bảo quản. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà sau khi sấy khô, được xử lý bằng, ví dụ, nước và sau đó lại được sấy khô, ví dụ phủ lót.

Thông thường, trong xử lý hạt, cần phải bảo đảm rằng, lượng hợp chất có công thức (I) và/hoặc các chất phụ gia khác áp dụng lên hạt được chọn theo cách sao cho, sự nảy mầm của hạt không bị ảnh hưởng và thực vật nảy sinh từ hạt không bị tổn hại. Điều này cần phải được bảo đảm, nhất là trong trường hợp các hoạt chất mà có thể biểu hiện các tác dụng gây độc cho thực vật với tỷ lệ áp dụng nhất định.

Hợp chất có công thức (I) thông thường được áp dụng lên hạt ở dạng công thức phối chế thích hợp. Công thức phối chế và quy trình xử lý hạt thích hợp là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực.

Hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển đổi thành chế phẩm xử lý hạt

thông thường, như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, huyền phù đặc hoặc các hỗn hợp phù khác dùng cho hạt và cả dạng công thức phối chế ULV.

Các công thức phối chế này được tạo ra theo cách đã biết, bằng cách trộn kết hợp hợp chất có công thức (I) với các chất phụ gia thông thường, ví dụ chất độn và dung môi thông thường hoặc chất pha loãng, chất nhuộm màu, chất làm ẩm, chất phân tán, chất nhũ hóa, các chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất kết dính, gibberelin và cả nước.

Chất nhuộm màu hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là toàn bộ các chất nhuộm màu thông thường cho các mục đích này. Có thể sử dụng các sắc tố ít hòa tan trong nước hoặc chất nhuộm màu hòa tan trong nước. Ví dụ bao gồm cả chất nhuộm màu đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Đỏ sắc tố 112 và C.I. Đỏ dung môi 1.

Chất làm ẩm hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất tăng cường sự làm ẩm và được sử dụng thông thường trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Được ưu tiên là sử dụng alkyl naphtalensulphonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphtalensulphonat.

Chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation được sử dụng thông thường trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Được ưu tiên là sử dụng chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp gồm các chất phân tán không ion hoặc anion. Chất phân tán không ion thích hợp bao gồm đặc biệt là các polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristyrylphenol polyglycol ete và các dẫn xuất phosphat hóa hoặc sulphat hóa của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là lignosulphonat, muối axit polyacrylic và chất ngưng tụ arylsulphonat/formaldehyt.

Các chất chống tạo bọt mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất ngăn chặn sự tạo bọt được sử dụng thông thường trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được ưu tiên sử dụng.

Chất bảo quản mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất hữu dụng cho các mục đích này trong các chế phẩm hóa nông. Các ví dụ bao gồm diclophen và rượu benzylic hemiformal.

Chất làm đặc thứ cấp mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất có thể được sử dụng cho các mục đích này trong các chế phẩm hóa nông. Các ví dụ được ưu tiên bao gồm dẫn xuất xenluloza, dẫn xuất của axit acrylic, xanthan, sét cải biến và silic oxit nghiền mịn.

Chất kết dính hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế là tất cả các chất kết dính thông thường hữu dụng trong các sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyl và tyloza.

Giberelin mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế tốt hơn là các giberelin A1, A3 (= axit giberelic), A4 và A7; đặc biệt ưu tiên là sử dụng axit giberelic. Các giberelin đã được biết (xem trong tài liệu R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

Chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế có thể được sử dụng để xử lý nhiều loại hạt khác nhau, theo cách trực tiếp hoặc sau khi pha loãng trước với nước. Ví dụ, các sản phẩm cô đặc hoặc chế phẩm có thể thu được từ chúng bằng cách pha loãng với nước có thể được sử dụng để xử lý hạt của ngũ cốc, như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, và tiểu hắc mạch, và cả để xử lý hạt của ngô, lúa, cải dầu, đậu Hà Lan, đậu, bông, hướng dương, đậu tương và củ cải đường, hoặc theo các khác, để xử lý hạt của nhiều loại rau khác nhau. Chế phẩm xử lý hạt có thể sử dụng theo sáng chế, hoặc dạng sử dụng pha loãng cả nó cũng có thể được sử dụng để xử lý hạt của thực vật chuyển gen.

Để xử lý hạt bằng chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế, hoặc các dạng sử dụng điều chế từ chúng, tất cả các đơn vị kết hợp có thể sử dụng được theo cách thông thường trong xử lý hạt đều là hữu ích. Cụ thể, quy trình trong xử lý hạt đó là đưa hạt vào trong thiết bị trộn vận hành theo từng lô hoặc vận hành liên tục, bổ sung lượng chế phẩm xử lý hạt mong muốn, ở dạng nguyên như vậy hoặc sau khi pha loãng trước

với nước và trộn kết hợp cho tới khi công thức phối chế được phân bố đồng đều lên hạt. Nếu thích hợp, thao tác này được tiếp theo bằng thao tác làm khô.

Tỷ lệ áp dụng của chế phẩm xử lý hạt hữu dụng theo sáng chế có thể thay đổi trong một phạm vi tương đối rộng. Tỷ lệ này được định hướng bằng hàm lượng cụ thể của hợp chất có công thức (I) trong chế phẩm và bởi loại hạt. Tỷ lệ áp dụng của hợp chất có công thức (I) thông thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 50g trên kilogram hạt, tốt hơn từ 0,01 đến 15g trên kilogram hạt.

Sử dụng trong lĩnh vực sức khỏe động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, tức là, trong lĩnh vực thuốc thú y, các hoạt chất theo sáng chế hoạt động chống lại động vật ký sinh, đặc biệt là ngoại ký sinh trùng hoặc theo cách khác, trong phương án khác, chống lại nội ký sinh trùng. Thuật ngữ "nội ký sinh trùng" bao gồm đặc biệt là giun sán như sán dây, giun tròn hoặc sán lá, và động vật nguyên sinh như cầu trùng. Ngoại ký sinh trùng điển hình và tốt hơn là động vật chân khớp, đặc biệt là côn trùng như ruồi (đốt và liếm), ấu trùng ruồi ký sinh, chấy rận, chấy, rận chim, bọ chét và loài tương tự; hoặc ve bét như ve, ví dụ ve cứng hoặc ve mềm, hoặc các loại mạt như ghẻ, mạt mùa gặt, mạt chim và tương tự, và cả các ngoại ký sinh trùng thủy sinh như phân lớp chân chèo.

Trong lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) không gây độc đối với động vật máu nóng thích hợp để diệt trừ ký sinh trùng xuất hiện trong nhân giống động vật và chăn nuôi động vật ở gia súc, động vật gây giống, động vật trong vườn thú, động vật thí nghiệm, động vật thực nghiệm và động vật nuôi trong gia đình. Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính chống lại tất cả hoặc các giai đoạn phát triển đặc hiệu của ký sinh trùng.

Gia súc nông nghiệp bao gồm, ví dụ, động vật có vú như cừu, dê, ngựa, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, tuần lộc, đà ma, và nhất là gia súc và lợn; gia cầm như gà tây, vịt, ngỗng và nhất là gà; cá và các loài giáp xác, ví dụ trong nuôi trồng thủy sản và cả côn trùng như ong.

Động vật nuôi trong gia đình bao gồm, ví dụ, động vật có vú, như chuột đồng, chuột bạch, chuột cống, chuột nhắt, sóc sinsin, chồn sương và đặc biệt là chó, mèo,

chim cảnh, bò sát, động vật lưỡng cư và cá cảnh.

Theo một phương án ưu tiên, hợp chất có công thức (I) được dùng cho động vật có vú.

Theo phương án ưu tiên khác, hợp chất có công thức (I) được dùng cho chim, cụ thể là chim cảnh và đặc biệt là gia cầm.

Việc sử dụng hợp chất có công thức (I) trong diệt trừ động vật ký sinh dự định để làm giảm hoặc phòng ngừa sự ốm yếu, các trường hợp tử vong và sự suy giảm các đặc tính (trong trường hợp thịt, sữa, len, da sống, trứng, mật và đặc tính tương tự), như vậy cho phép việc chăn nuôi động vật kinh tế hơn và đơn giản hơn và động vật có thể có được sức khỏe tốt hơn.

Liên quan đến lĩnh vực sức khỏe động vật, thuật ngữ "kiểm soát" hoặc "việc kiểm soát" có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) có hiệu quả trong việc làm giảm tỷ lệ mắc ký sinh trùng cụ thể ở một động vật bị nhiễm bởi ký sinh trùng này tới mức độ không độc. Cụ thể hơn nữa, thuật ngữ "việc kiểm soát" trong bối cảnh theo sáng chế này có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) có thể tiêu diệt ký sinh trùng tương ứng, ức chế sự phát triển hoặc ức chế sự tăng sinh của nó.

Các loại ký sinh trùng này bao gồm:

Thuộc bộ *Anoplurida*, ví dụ, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phthirus spp.*, *Solenopotes spp.*; các ví dụ cụ thể là: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

Thuộc bộ *Mallophagida* và các phân bộ *Amblycerina* và *Ischnocerina*, ví dụ, *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*; các ví dụ cụ thể là: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

Thuộc bộ *Diptera* và các phân bộ *Nematocerina* và *Brachycerina*, ví dụ, *Aedes spp.*,

Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhelmia spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp., Rhinoestrus spp., Tipula spp.; các ví dụ cụ thể là: *Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles gambiae, Anopheles maculipennis, Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Fannia canicularis, Sarcophaga carnaria, Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Simulium reptans, Phlebotomus papatasi, Phlebotomus longipalpis, Odagmia ornata, Wilhelmia equina, Boophthora erythrocephala, Tabanus bromius, Tabanus spodopterus, Tabanus atratus, Tabanus sudeticus, Hybomitra ciurea, Chrysops caecutiens, Chrysops relictus, Haematopota pluvialis, Haematopota italica, Musca autumnalis, Musca domestica, Haematobia irritans irritans, Haematobia irritans exigua, Haematobia stimulans, Hydrotaea irritans, Hydrotaea albipuncta, Chrysomya clopyga, Chrysomya bezziana, Oestrus ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma lineatum, Przhevalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena capreoli, Lipoptena cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, Gasterophilus intestinalis, Gasterophilus haemorroidalis, Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricornis, Gasterophilus pecorum, Braula coeca;*

Thuộc bộ *Siphonapterida*, ví dụ, *Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.*; các ví dụ cụ thể là: *Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;*

Thuộc bộ *Heteropterida*, ví dụ, *Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.*

Thuộc bộ *Blattarida*, ví dụ, *Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica* và *Supella spp.* (ví dụ, *Supella longipalpa*);

Thuộc phân lớp *Acari (Acarina)* và các bộ *Meta-* và *Mesostigmata*, ví dụ, *Argas spp.,*

Ornithodoros spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (the original genus of multihost ticks), *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; các ví dụ cụ thể là: *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*, *Haemaphysalis cinnabarina*, *Haemaphysalis otophila*, *Haemaphysalis leachi*, *Haemaphysalis longicorni*, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor albipictus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma mauritanicum*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma cajennense*, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Varroa jacobsoni*;

Thuộc bộ *Actinedida* (*Prostigmata*) và *Acaridida* (*Astigmata*), ví dụ, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. và *Laminosioptes* spp.; các ví dụ cụ thể là: *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*, *Demodex caprae*, *Demodex equi*, *Demodex caballi*, *Demodex suis*, *Neotrombicula autumnalis*, *Neotrombicula desaleri*, *Neoschongastia xerothermobia*, *Trombicula akamushi*, *Otodectes cynotis*, *Notoedres cati*, *Sarcoptes canis*, *Sarcoptes bovis*, *Sarcoptes ovis*, *Sarcoptes rupicaprae* (= *S. caprae*), *Sarcoptes equi*, *Sarcoptes suis*, *Psoroptes ovis*, *Psoroptes cuniculi*, *Psoroptes*

equi, Chorioptes bovis, Psorergates ovis, Pneumonyssoides mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

Thuộc phân lớp phân lớp chân chèo với bộ *Siphonostomatoida* đặc biệt là chi *Lepeophtheirus* và *Caligus*; loài *Lepeophtheirus salmonis*, *Caligus elongatus* và *Caligus clemensi* có thể được kể đến để làm ví dụ và với sự ưu tiên đặc biệt.

Nói chung, các hoạt chất theo sáng chế có thể được sử dụng trực tiếp khi chúng được sử dụng trong điều trị cho động vật. Tốt hơn hoạt chất theo sáng chế được sử dụng (được dùng) ở dạng dược phẩm mà dược phẩm này có thể chứa tá dược và/hoặc chất hỗ trợ dược dụng đã biết trong lĩnh vực.

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật và trong chăn nuôi, các hoạt chất được sử dụng (= được dùng) theo cách đã biết, bằng cách dùng theo đường tiêu hóa dưới dạng, ví dụ, viên nén, viên nang, dạng lỏng, dạng uống, hạt, hồ nhão, dạng tiêm nhanh, dạng gia công thấm qua và viên đặt, bằng cách dùng theo đường ngoài tiêu hóa, ví dụ bằng cách tiêm (trong cơ, dưới da, tĩnh mạch, trong phúc mạc, không kể đường khác), cấy ghép, bằng cách dùng theo đường mũi, bằng cách dùng theo đường da ở dạng, ví dụ, nhúng hoặc ngâm, phun, rót lên và chấm lên, rửa và thoa lên và cả với sự hỗ trợ của các vật tạo khuôn chứa hoạt chất, như vòng đeo cổ, vòng đeo ở tai, vật đeo ở đuôi, dải đeo ở chi, các dây đeo, các dụng cụ đánh dấu, v.v.. Hoạt chất có thể được phối chế thành dầu gội hoặc thành công thức phối chế thích hợp có thể áp dụng được ở dạng sol khí hoặc dạng phun không tạo áp, ví dụ bơm phun và phun tán.

Trong trường hợp sử dụng cho gia súc, gia cầm, động vật cảnh trong gia đình, v.v., hoạt chất theo sáng chế có thể được sử dụng ở dạng công thức phối chế (ví dụ, bột, bột có thể thấm ướt ["WP"], nhũ tương, dạng nhũ dầu ["EC"], chế phẩm chảy tự do, dung dịch đồng nhất và huyền phù đậm đặc ["SC"]), các dạng này chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 1% đến 80% theo khối lượng, trực tiếp hoặc sau khi pha loãng (ví dụ, pha loãng 100 đến 10000 lần), hoặc chúng có thể được sử dụng ở dạng tắm hóa chất.

Trong trường hợp sử dụng trong lĩnh vực sức khỏe động vật, hoạt chất theo sáng chế, nhằm để mở rộng phổ hoạt tính, có thể được sử dụng kết hợp với chất hiệp lực, chất xua đuổi hoặc các hoạt chất khác, ví dụ chất diệt ve bét, chất diệt côn trùng,

chất diệt giun sán, chất chống động vật nguyên sinh. Các thành phần kết hợp tiềm năng với hợp chất có công thức (I) theo sáng chế, trong trường hợp áp dụng cho sức khỏe động vật, có thể là một hoặc nhiều hợp chất từ các nhóm (In-1) đến (In-25).

(In-1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ cacbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC và xylylcarb; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là bendiocarb, carbaryl, methomyl, promaxyl và propoxur; hoặc các phosphat hữu cơ, ví dụ acephate, azamethiphos, azinphos (-metyl, -etyl), cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos (-metyl), coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos (-metyl), profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là azamethiphos, chlorfenvinphos, chlorpyrifos, coumaphos, cythioate, diazinon (dimpylate), dichlorvos (DDVP), dicrotophos, dimethoate, ethion (diethion), famphur (famphos), fenitrothion, fenthion (MPP), heptenophos, malathion, naled, phosmet (PMP, phtalofos) phoxim, propetamphos, temephos, tetrachlorvinphos (CVMP) và triclofon/metrifonate.

(In-2) Các chất đối kháng kênh clorua qua cổng GABA, ví dụ organoclos, ví dụ bromocyclene, chlordane và endosulfan (alpha-), heptachlor, lindane và toxaphene; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là endosulfan (alpha-) và lindane; hoặc

các fiprole (phenylpyrazol), ví dụ acetoprole, ethiprole, fipronil, pyrafluprole, pyriprole, rizazol; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là fipronil và pyriprole; hoặc

các arylisoxazolin, arylpyroline, arylpyrolidin, ví dụ fluralaner (đã biết trong tài liệu WO2009/2024541, ví dụ 11-1; nhưng cũng cả các hợp chất trong tài liệu WO2012007426, WO2012042006, WO2012042007, WO2012107533, WO2012120135, WO2012165186, WO2012155676, WO2012017359, WO2012127347, WO2012038851, WO2012120399, WO2012156400, WO2012163959, WO2011161130, WO2011073444, WO2011092287, WO2011075591, WO2011157748, WO 2007/075459, WO 2007/125984, WO 2005/085216, WO 2009/002809), afoxolaner (ví dụ, trong tài liệu WO2011149749) và các arylpyroline liên quan về cấu trúc (ví dụ, đã biết trong tài liệu WO2009/072621, WO 2010020522, WO 2009112275, WO 2009097992, WO 2009072621, JP 2008133273, JP 2007091708), hoặc arylpyrolidins (ví dụ, trong tài liệu WO2012004326, WO2012035011, WO2012045700, WO 2010090344, WO 2010043315, WO 2008128711, JP 2008110971), và các hợp chất từ nhóm hợp chất được gọi là metadiazin (ví dụ, đã biết trong tài liệu WO2012020483, WO2012020484, WO2012077221, WO2012069366, WO2012175474, WO2011095462, WO2011113756, WO2011093415, WO2005073165); trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là afoxolaner và fluralaner.

(In-3) Các chất điều biến kênh natri/các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin (d-cis-trans, d-trans), bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-xylopentenyl, bioresmethrin, xyloprothrin, xyfluthrin (beta-), cyhalothrin (gamma-, lambda-), cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), cyphenothrin [(1*R*)-*trans* isomer], deltamethrin, dimefluthrin, empenthrin [(*EZ*)-(1*R*) isomer], esfenvalerate, etofenprox, fenprothrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, fluvalinate (tau-), halfenprox, imiprothrin, metofluthrin, permethrin, phenothrin [(1*R*)-*trans* isomer], prallethrin, profluthrin, pyrethrins (pyrethrum), resmethrin, RU 15525, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin [(1*R*) isomer], tralomethrin, transfluthrin và ZXI 8901; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là các pyrethroid loại I allethrin, bioallethrin,

permethrin, phenothrin, resmethrin, tetramethrin và các pyrethroid loại II (alphaxyanopyrethroid) alpha-cypermethrin, xyfluthrin (beta-), cyhalothrin (lambda-), cypermethrin (alpha-, zeta-), deltamethrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, fluvalinate (tau-), và các pyrethroid không este etofenprox và silafluofen; hoặc các hợp chất clo hữu cơ, ví dụ DDT hoặc metoxychlor. Các hoạt chất thuộc nhóm này đặc biệt rất thích hợp làm các thành phần kết hợp, vì chúng có tác dụng xua đuổi tiếp xúc kéo dài hơn và do đó mở rộng phổ hoạt tính để bao gồm cả thành phần này.

(In-4) Các chất chủ vận thụ thể axetylcholine nicotinic, ví dụ các neonicotinoid, ví dụ acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, imidaclothin, nitenpyram, thiacloprid, thiamethoxam; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram và thiacloprid; hoặc nicotine.

(In-5) Các chất điều biến thụ thể axetylcholine dị lập thể (các chất chủ vận), ví dụ các spinosyn, ví dụ spinetoram và spinosad; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là spinosad và spinetoram.

(In-6) Các chất kích hoạt kênh clorua, ví dụ các avermectin/milbemycin, ví dụ abamectin, doramectin, emamectin benzoat, eprinomectin, ivermectin, latidectin, lepimectin, milbemycin oxime, milbemectin, moxidectin và selamectin; các indol terpenoid, ví dụ nodulisporic acid derivatives, đặc biệt là axit nodulisporic A; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là doramectin, eprinomectin, ivermectin, milbemycin oxime, moxidectin, selamectin và axit nodulisporic A.

(In-7) Các chất tương tự hormone ấu trùng, ví dụ hydroprene (S-), kinoprene, methoprene (S-); hoặc fenoxycarb; pyriproxyfen; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là methoprene (S-) và pyriproxyfen.

(In-8) Các chất ức chế sinh trưởng của các loại mật, ví dụ clofentezine, diflovidazin, hexythiazox, etoxazol; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là etoxazol.

(In-9) Các chất chủ vận thụ thể Slo-1 và latrophilin, ví dụ các depsipeptit vòng, ví dụ

emodepsit và tiền dược chất PF1022A của nó (đã biết trong tài liệu EP 382173, hợp chất I); trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là emodepsit.

(In-10) Các chất ức chế quá trình phosphoryl hóa oxy hóa, các chất phá vỡ ATP, ví dụ diafenthiuron.

(In-12) Các chất đối kháng thụ thể axetylcholine nicotinergeric, ví dụ bensultap, cartap (hydroclorua), thiocylam, và thiosultap (natri).

(In-13) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 0, ví dụ các benzoylure, ví dụ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là diflubenzuron, fluazuron, lufenuron và triflumuron.

(In-14) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 1, ví dụ buprofezin.

(In-15) Các chất ức chế sự lột xác, ví dụ cyromazin và dicyclanil; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là cyromazin và dicyclanil.

(In-16) Các chất chủ vận/các chất phá vỡ hormone lột xác, ví dụ các diaxylhydrazin, ví dụ chromafenozide, halofenozide, metoxyfenozide và tebufenozide.

(In-17) Các chất chủ vận octopamin, ví dụ amitraz, cymiazol, chlordimeform và demiditraz; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là amitraz, cymiazol và demiditraz.

(In-18) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức III, ví dụ hydrametylnone; acequinocyl; fluacrypyrim.

(In-19) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức I, ví dụ từ nhóm các chất diệt ve bét METI, ví dụ fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu tiên ở đây là fenpyroximate, pyrimidifen và tolfenpyrad;

(In-20) Các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ indoxacarb và metaflumizone; trong các ứng dụng chống lại ngoại ký sinh trùng, đặc biệt được ưu

tiên ở đây là indoxacarb và metaflumizone.

(In-21) Các chất ức chế của axetyl-CoA cacboxylaza, ví dụ các dẫn xuất axit tetronic, ví dụ spirodiclofen và spiromesifen; hoặc các dẫn xuất axit tetramic, ví dụ spirotetramat.

(In-22) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức II, ví dụ xyenopyrafen.

(In-23) Các chất tác động lên thụ thể ryanodin, ví dụ các diamit, ví dụ flubendiamit, chlorantraniliprole (Rynaxypyr), xyantraniliprole (Cyazypyr) và cả 3-bromo-N-{2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)cacbamoyl]phenyl}-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-cacboxamit (đã biết trong tài liệu WO2005/077934) hoặc metyl 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl}amino)benzoyl]-1,2-dimetylhydrazincacboxylat (đã biết trong tài liệu WO2007/043677).

(In-24) Các hoạt chất khác với các cơ chế tác động chưa biết, ví dụ azadirachtin, amidoflomet, benzoximate, bifenazate, chinomethionat, cryolite, xyflumetofen, dicofol, fluensulfone (5-clo-2-[(3,4,4-triflobut-3-en-1-yl)sulphonyl]-1,3-thiazol), flufenerim, pyridalyl và pyrifluquinazon; và ngoài ra còn các chế phẩm dựa vào *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) và các hoạt chất đã biết sau: 4-{{[(6-bromopyrid-3-yl)metyl](2-floetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115644), 4-{{[(6-flopyrid-3-yl)metyl](2,2-difloetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115644), 4-{{[(2-clo-1,3-thiazol-5-yl)metyl](2-floetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115644), 4-{{[(6-clopyrid-3-yl)metyl](2-floetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115644), 4-{{[(6-clopyrid-3-yl)metyl](2,2-difloetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115644), 4-{{[(6-clo-5-flopyrid-3-yl)metyl](metyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115643), 4-{{[(5,6-diclopyrid-3-yl)metyl](2-floetyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115646), 4-{{[(6-clo-5-flopyrid-3-yl)metyl](xyclopropyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu WO 2007/115643), 4-{{[(6-clopyrid-3-yl)metyl](xyclopropyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu EP-A-0 539 588), 4-{{[(6-clopyrid-3-yl)metyl](metyl)amino}furan-2(5H)-on (đã biết trong tài liệu EP-A-0 539 588), [(6-clopyridin-3-yl)metyl](metyl)oxido- λ^4 -sulphanylidenxyanamit (đã biết

trong tài liệu WO 2007/149134), [1-(6-clopyridin-3-yl)etyl](metyl)oxido- λ^4 -sulphanylidenxyanamit (đã biết trong tài liệu WO 2007/149134), [(6-triflometylpyridin-3-yl)metyl](metyl)oxido- λ^4 -sulphanylidenxyanamit (đã biết trong tài liệu WO 2007/095229), sulfoxaflor (tương tự, đã biết trong tài liệu WO 2007/149134), 11-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-12-hydroxy-1,4-dioxa-9-azadispiro [4.2.4.2]tetradec-11-en-10-on (đã biết trong tài liệu WO 2006/089633), 3-(4'-flo-2,4-dimetylbi-phenyl-3-yl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết trong tài liệu WO 2008/067911), 1-[2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulphinyl]phenyl]-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã biết trong tài liệu WO 2006/043635), [(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(xyclopropylcacbonyl)oxy]-6,12-dihydroxy-4,12b-dimetyl-11-oxo-9-(pyridin-3-yl)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahydro-2H,11H-benzo[f]pyrano[4,3-b]chromen-4-yl]metyl xyclopropanecacboxylat (đã biết trong tài liệu WO 2006/129714), 2-xyano-3-(diflometoxy)-N-etyl-benzensulphonamit (đã biết trong tài liệu WO 2005/035486), N-[1-(2,3-dimetylphenyl)-2-(3,5-dimetylphenyl)etyl]-4,5-dihydro-2-thiazolamin (đã biết trong tài liệu WO 2008/104503); penigequinolon A (đã biết trong tài liệu EP 2248422 (hợp chất I) và WO 2009/060015 (hợp chất No. 11)).

(In-25) Các chất hợp lực thích hợp trong trường hợp sử dụng cùng với chất diệt ngoại ký sinh trùng ở đây bao gồm MGK264 (*N*-octylbixycloheptenecacboxamit), piperonyl butoxit (PBO) và verbutin; đặc biệt được ưu tiên ở đây là piperonyl butoxit và MGK264.

Ngoài các nhóm này ra, cũng có thể sử dụng các chất xua đuổi thời hạn ngắn trong các hỗn hợp hoặc ứng dụng kết hợp. Các ví dụ minh họa đó là DEET (N,N-dietyl-3-metylbenzamid), icaridin (axit 1-piperidincacboxylic), (1S, 20S)-2-metylpiperidinyl-3-xyclohexene-1-cacboxamid (SS220), indalone (butyl 3,4-dihydro-2,2-dimetyl-4-oxo-2H-pyran-6-cacboxylat), dihydronepetalactons, nootkatone, IR3535 (etyl este của axit 3-[N-butyl-N-axetyl]-aminopropionic), 2-etylhexan-1,3-diol, (1R,2R,5R)-2-(2-hydroxypropan-2-yl)-5-metyl-xyclohexan-1-ol, dimetyl benzen-1,2-dicacboxylat, axit dodecanoic, undecan-2-on, N,N-dietyl-2-phenylaxetamid và các tinh dầu hoặc các thành phần thực vật khác có tác dụng xua đuổi đã biết, ví dụ borneol, callicarpenal, 1,8-cineol (eucalyptol), carvacrol, b-citronellol, a-copaene, coumarin

(hoặc các dẫn xuất tổng hợp của nó đã biết trong tài liệu US20120329832). Icaridin, indalone và IR3535 (etyl este của axit 3-[N-butyl-N-axetyl]-aminopropionic) là đặc biệt được ưu tiên để sử dụng chống lại ngoại ký sinh trùng.

Trong các nhóm từ (I-1) đến (I-25) nêu trên, các nhóm sau được ưu tiên sử dụng làm các thành phần kết hợp: (In-2), (In-3), (In-4), (In-5), (In-6), (In-17), (In-25).

Các ví dụ đặc biệt ưu tiên về hoạt chất, chất hợp lực hoặc chất xua đuổi có tác dụng diệt côn trùng hoặc diệt ve bét làm các thành phần kết hợp của hợp chất theo sáng chế có công thức (I) đó là afoxolaner, allethrin, amitraz, bioallethrin, chlothianidin, xyfluthrin (beta-), cyhalothrin (lambda-), cymiazol, cypermethrin (alpha-, zeta-), cyphenothrin, deltamethrin, demiditraz, dinotefuran, doramectin, eprinomectin, etofenprox, fenvalerate, fipronil, fluazuron, flucythrinate, flumethrin, fluralaner, fluvalinate (tau-), icaridin, imidacloprid, ivermectin, MGK264, milbemycin oxime, moxidectin, nitenpyram, permethrin, phenothrin, piperonyl butoxit, pyriprole, resmethrin, selamectin, silafluofen, spinetoram, spinosad, tetramethrin, thiacloprid.

Kiểm soát vector

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng trong việc kiểm soát vector. Trong bối cảnh theo sáng chế, vector là ngành chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc lớp nhện, có khả năng truyền tác nhân gây bệnh, ví dụ, virus, ấu trùng, sinh vật đơn bào và vi khuẩn, từ ổ chứa (thực vật, động vật, người, v.v.) sang vật chủ. Tác nhân gây bệnh có thể được truyền theo đường cơ học (ví dụ, đau mắt hột bởi các loại ruồi không đốt) sang vật chủ hoặc qua tiêm đốt (ví dụ, ký sinh trùng sốt rét bởi muỗi) vào vật chủ.

Ví dụ về các vector và bệnh hoặc tác nhân gây bệnh mà chúng truyền là:

1) Muỗi

- Anopheles: sốt rét, bệnh giun chỉ;
- Culex: viêm não Nhật Bản, bệnh giun chỉ, các bệnh virus khác, truyền ấu trùng;
- Aedes: sốt vàng, sốt xuất huyết, bệnh giun chỉ, các bệnh virus khác;
- Simuliidae: truyền ấu trùng, đặc biệt là *Onchocerca volvulus*;

- 2) Chấy rận: nhiễm trùng da, sốt phát ban do chấy rận;
- 3) Bọ chét: bệnh dịch, sốt phát ban địa phương;
- 4) Ruồi: bệnh ngủ (trypanosomiasis); dịch tả, các bệnh do vi khuẩn khác;
- 5) Ve bét: bệnh ghẻ, sốt phát ban do chấy rận, bệnh sốt do rickettsia, bệnh tularaemia, bệnh viêm não Saint Louis, bệnh viêm não do tích đốt (TBE), sốt xuất huyết Crimean–Congo, bệnh do xoắn khuẩn borrelia;
- 6) Các loại tích: bệnh do xoắn khuẩn borellia như *Borrelia duttoni*, viêm não do tích đốt, sốt Q (*Coxiella burnetii*), bệnh babesia (*Babesia canis canis*).

Ví dụ về các vectơ trong bối cảnh theo sáng chế đó là côn trùng, ví dụ rệp, ruồi, rầy hoặc bọ trĩ, các vectơ này có thể truyền virus trên thực vật sang thực vật. Các vectơ khác có khả năng truyền virus trên thực vật đó là ve bét ở nhện, chấy rận, bọ cánh cứng và giun tròn.

Ví dụ khác về các vectơ theo sáng chế bao gồm côn trùng và lớp nhện như muỗi, đặc biệt là giống *Aedes*, *Anopheles*, ví dụ *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (sốt rét) và *Culex*, chấy rận, bọ chét, ruồi, mạt và tích, các vectơ này có khả năng truyền tác nhân gây bệnh sang động vật và/hoặc người.

Việc kiểm soát vectơ cũng có thể nếu như hợp chất có công thức (I) phá vỡ tính kháng.

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng trong phòng ngừa bệnh và/hoặc tác nhân gây bệnh được truyền bởi các vectơ. Do đó, một khía cạnh khác theo sáng chế bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để kiểm soát vectơ, ví dụ trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong trồng rừng, trong các khu vườn và trong các cơ sở giải trí và cả trong bảo vệ nguyên liệu và các sản phẩm bảo quản.

Bảo vệ các nguyên liệu công nghiệp

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để bảo vệ các nguyên liệu công nghiệp chống lại sự tấn công hoặc phá hủy bởi côn trùng, ví dụ từ các bộ *Coleoptera*, *Hymenoptera*, *Isoptera*, *Lepidoptera*, *Psocoptera* và *Zygentoma*.

Các nguyên liệu công nghiệp trong ngữ cảnh này được hiểu có nghĩa là nguyên

liệu vô tri vô giác, tốt hơn như chất dẻo, chất dính kết, hồ dính, giấy và các-tông, da, gỗ, sản phẩm gỗ đã xử lý và chế phẩm phủ. Việc sử dụng theo sáng chế để bảo vệ gỗ là đặc biệt được ưu tiên.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) được sử dụng cùng với ít nhất một chất diệt côn trùng và/hoặc ít nhất một chất diệt nấm khác.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) là ở dạng chất diệt sinh vật gây hại sẵn sàng để dùng, có nghĩa là, các dạng này có thể được áp dụng lên nguyên liệu đích không cần làm biến đổi thêm. Chất diệt côn trùng hoặc chất trừ nấm thích hợp khác cụ thể là các chất đã nêu ở trên.

Một cách ngạc nhiên, cũng đã phát hiện ra rằng, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ các đối tượng tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là thân tàu thủy, màn hình, lưới, tòa nhà, nơi neo giữ tàu và các hệ thống truyền tín hiệu, chống lại sự cáu gổ. Tương tự, cũng có thể sử dụng hợp chất có công thức (I), riêng biệt hoặc trong các hỗn hợp cùng với các hoạt chất khác, làm các chất chống lại sự cáu gổ.

Kiểm soát động vật gây hại trong khu vực vệ sinh

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để kiểm soát động vật gây hại trong khu vực vệ sinh. Cụ thể hơn, sáng chế có thể được sử dụng trong khu vực gia đình, trong khu vực vệ sinh và trong bảo vệ các sản phẩm bảo quản, nhất là để kiểm soát côn trùng, lớp nhện và các loại mạt bắt gặp trong các không gian kín như khu vực nhà ở, các tòa nhà trong nhà máy, văn phòng, cabin phương tiện giao thông. Để kiểm soát động vật gây hại, hợp chất có công thức (I) được sử dụng duy nhất hoặc kết hợp với các hoạt chất khác và/hoặc các chất bổ trợ. Hợp chất theo sáng chế tốt hơn được sử dụng trong các sản phẩm diệt côn trùng trong gia đình. Hợp chất có công thức (I) có hiệu quả chống lại các loài nhện và kháng và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển.

Các sinh vật gây hại này bao gồm, ví dụ, các sinh vật gây hại từ lớp Arachnida, từ các bộ Scorpiones, Araneae và Opiliones, từ các lớp Chilopoda và Diplopoda, từ lớp Insecta bộ Blattodea, từ các bộ Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria hoặc

Orthoptera, Siphonaptera và Zygentoma và từ lớp Malacostraca bộ Isopoda.

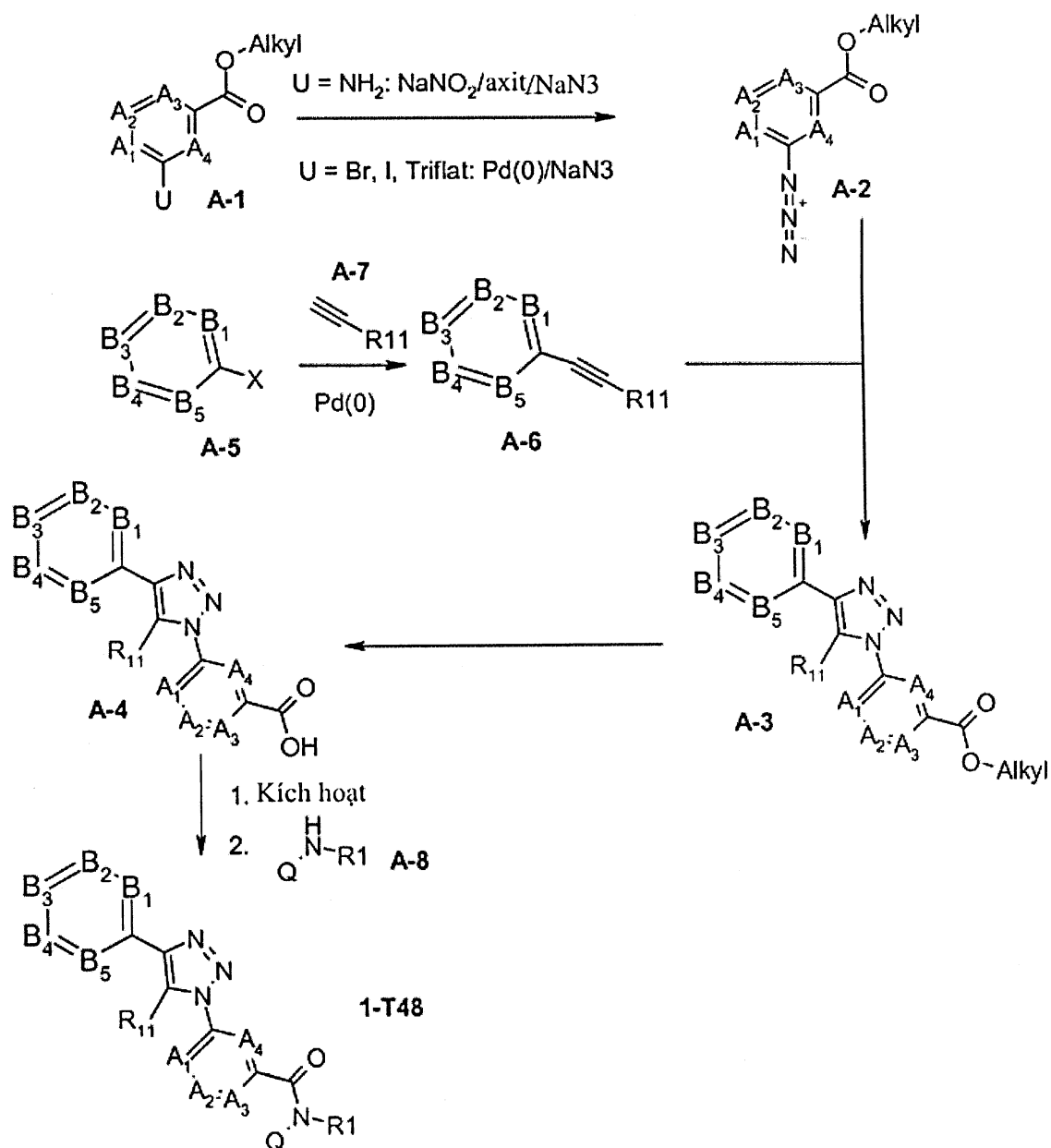
Ví dụ, việc ứng dụng được thực hiện ở dạng sản phẩm sol khí, sản phẩm phun không tạo áp lực, ví dụ, bơm và phun bụi, các hệ thống phun mù tự động, máy phun mù, ở dạng bột xốp, gel, các sản phẩm bốc hơi với viên nén bốc hơi được làm từ xenluloza hoặc chất dẻo, dụng cụ làm bay hơi chất lỏng, dụng cụ làm bay hơi gel và màng, dụng cụ làm bay hơi dẫn động bằng cánh quạt, các hệ thống làm bay hơi năng lượng tự do hoặc cưỡng bức, các giấy bắt nhậy, túi bắt nhậy và gel bắt nhậy, ở dạng hạt nhỏ hoặc bụi, trong các môi để phát tán hoặc trong các điểm đặt môi.

Quy trình điều chế

Hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế bằng các phương pháp thông thường đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực.

Hợp chất có công thức (I-T48) có thể được điều chế bằng quy trình được xác định trong sơ đồ phản ứng 1.

Sơ đồ phản ứng 1

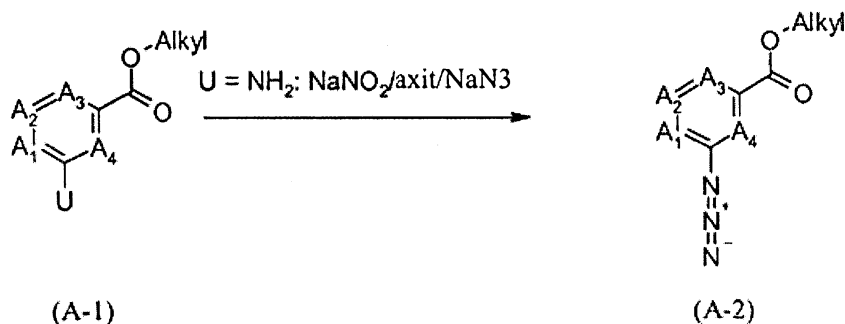


Các gốc A₁-A₄, B₁-B₅, alkyl, Q, R¹ và R¹¹ mỗi một gốc như được xác định ở trên. X là Cl, Br, I. U là amino, Br, I hoặc triflat.

Các hợp chất khởi đầu có công thức (A-1) (ví dụ, EP 1 253 128, p. 8-10) và (A-5) là đã biết, và một số trong số các hợp chất khởi đầu này có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu.

Giai đoạn 1 Azit

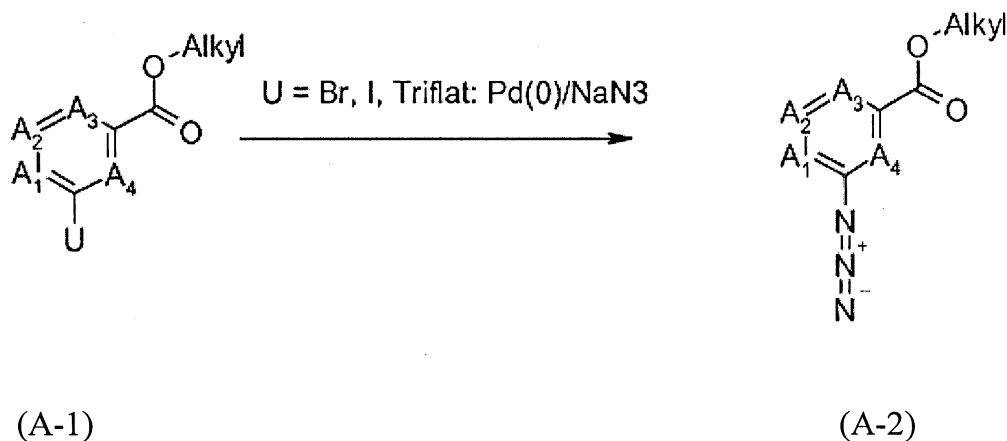
Giai đoạn 1 của quy trình điều chế các hợp chất theo sáng chế (I-T48):



Hợp chất có công thức chung (A-2) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu có công thức (A-1). Các gốc A_1 - A_4 và alkyl mỗi gốc như được xác định ở trên. Các hợp chất khởi đầu có công thức (A-1) là đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Các ví dụ bao gồm: methyl 5-amino-2-clobenzoat, etyl 5-amino-2-bromobenzoat, methyl 5-amino-2-clo-3-flobenzoat, etyl 5-amino-2-clonicotinat. Các hợp chất này có thể được điều chế, ví dụ, bằng các phương pháp được mô tả trong tài liệu WO2011/128251, p. 180; US2010/297073, p. 20; Winn, Martin; De, Biswanath; Zydowsky, Thomas M.; Altenbach, Robert J.; Basha, Fatima Z.; et al. Journal of Medicinal Chemistry, 36 (1993), p. 2676-2688. Các hợp chất còn chưa biết (A-2) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong điều chế các aryl azit từ các anilin (C. Grundmann in HoubenWeyl, vol. X/3, p. 801-802, Georg Thieme Verlag Stuttgart 1965)).

Theo cách khác, hợp chất có công thức chung (A-2) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu có công thức (A-1). Các gốc A_1 - A_4 và alkyl mỗi gốc như được xác định ở trên. Hợp chất khởi đầu có công thức (A-1) là đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Các ví dụ bao gồm: methyl 5-iodo-2-clobenzoat, methyl 5-bromo-2-clobenzoat, methyl 5-bromo-2-clo-3-flobenzoat, etyl 5-iodo-2-clonicotinat. Các hợp chất này có thể được điều chế, ví dụ, bằng các phương pháp được mô tả trong tài liệu US5250548, Ví dụ 208C; Winn, Martin; De, Biswanath; Zydowsky, Thomas M.; Altenbach, Robert J.;

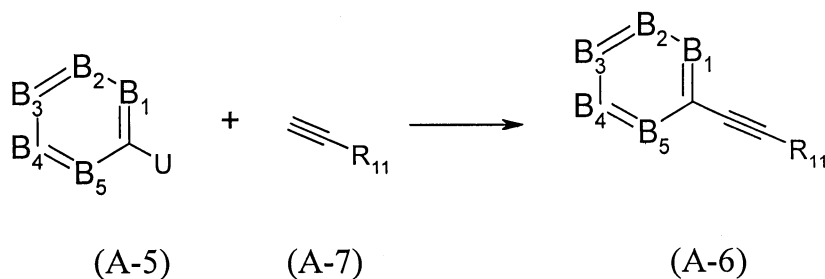
Basha, Fatima Z.; et al. Journal of Medicinal Chemistry, 36 (1993), p. 2676-2688.



Ngoài ra, các hợp chất (A-2) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong điều chế aryl azit từ aryl halogenua (ví dụ, WO 2010/8831, page 52).

Giai đoạn 2 Axetylen

Giai đoạn 2: Điều chế hợp chất khởi đầu có công thức A6



Các hợp chất mới có công thức chung (A-6) được điều chế tương tự như các phương pháp đã biết trong tài liệu (Chinchilla, Rafael; Najera, Carmen, Chemical Society Reviews (2011), 40(10), 5084-5121, Chinchilla, Rafael; Najera, Carmen, Chemical Reviews (Washington, DC, United States) (2007), 107(3), 874-922) từ nguyên liệu khởi đầu có công thức (A-7) với việc xúc tác nhờ bởi các chất xúc tác kim loại chuyển tiếp bao gồm paladi và đồng.

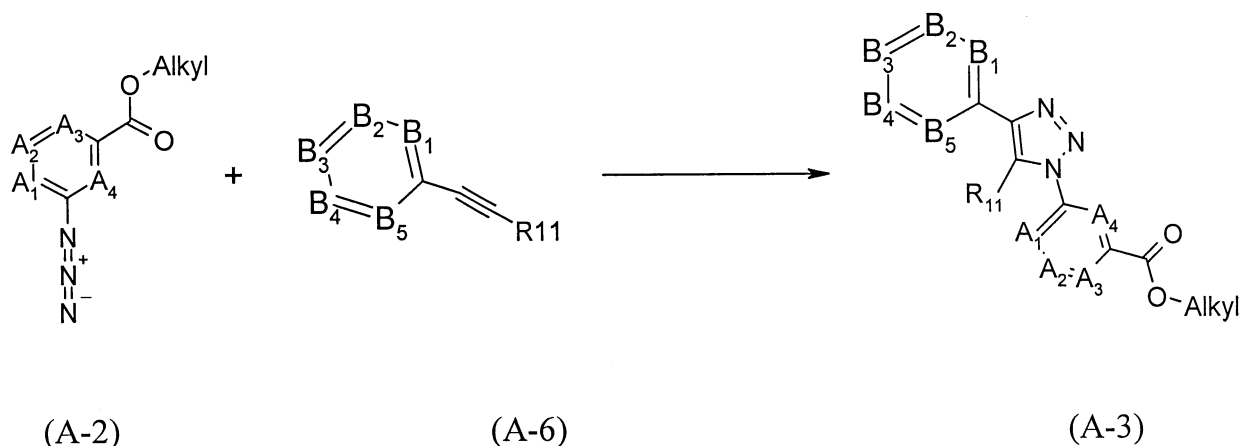
Các gốc B₁-B₅, R⁶ và U mỗi gốc như được xác định ở trên. Ví dụ, U là brom, iot hoặc triflat.

Các hợp chất khởi đầu có công thức (A-5) là đã biết và một số có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Các ví dụ bao gồm 2-bromo-1,3-

diclo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen, 2-bromo-1,3-dimetyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen, 2-bromo-1-etyl-3-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen, 2-bromo-1-clo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometyl)benzen, 2-bromo-1-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometyl)benzen, 2-bromo-1-clo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometoxy)benzen, 2-bromo-1-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometoxy)benzen. Các hợp chất này có thể được điều chế, ví dụ, bằng các phương pháp được mô tả trong tài liệu EP 1 253 128, các trang 8-10.

Các hợp chất khởi đầu có công thức (A-7) là đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Nếu $R^{11}=H$, trong quy trình này có thể sử dụng nhóm bảo vệ hơn là R^{11} . Ví dụ, nhóm bảo vệ thích hợp là trimetylsilyl, trietylsilyl và dimethylhydroxymetyl. Các nhóm bảo vệ thích hợp khác để đưa vào và tách ra được mô tả trong tài liệu [xem trong tài liệu lists in Greene's protective groups in organic synthesis, 4th edition, P. G. M. Wuts, T. W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey, 2007, pages 927-933.]

Giai đoạn 3: Đóng vòng



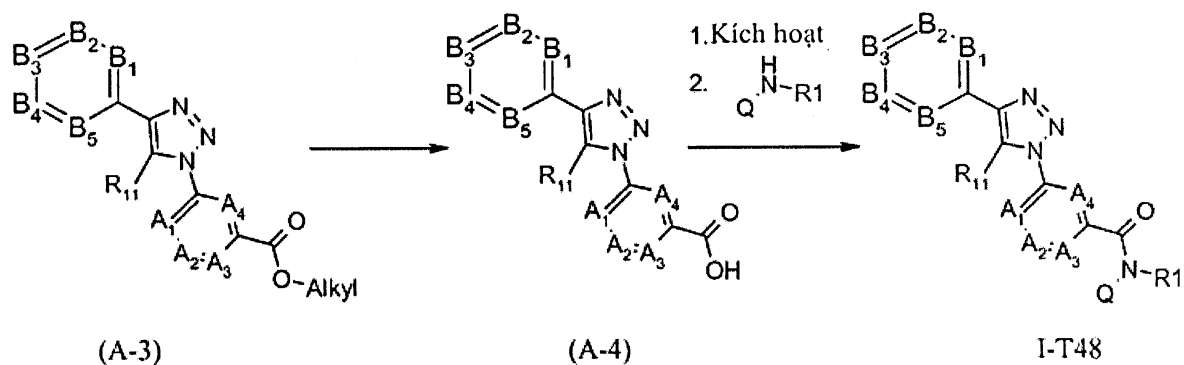
Các hợp chất mới có công thức chung (A-3) được điều chế bằng cách cho các azit có công thức (A-2) phản ứng với axetylen có công thức (A-6).

Các gốc A₁-A₄, B₁-B₅, R¹¹ và alkyl mỗi gốc như được xác định ở trên.

Việc điều chế hợp chất có công thức (A-2) và (A-6) được mô tả ở trên. Ví dụ về các hợp chất có công thức (A-2) bao gồm: metyl 5-azido-2-clobenzoat, etyl 5-azido-2-bromobenzoat, metyl 5-azido-2-clo-3-flobenzoat, etyl 5-azido-2-clonicotinat. Ví dụ về

các hợp chất có công thức (Z6) bao gồm: 2-etylnyl-1,3-diclo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen,
 2-etylnyl-1,3-dimetyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen,
 2-etylnyl-1-etyl-3-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen,
 2-etylnyl-1-clo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometyl)benzen,
 2-etylnyl-1-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometyl)benzen,
 2-etylnyl-1-clo-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometoxy)benzen,
 2-etylnyl-1-metyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-3-(triflometoxy)benzen. Phản ứng được thực hiện trong điều kiện được mô tả trong tài liệu, ví dụ WO2010008831, p. 52.; WO2012175474, p. 118.

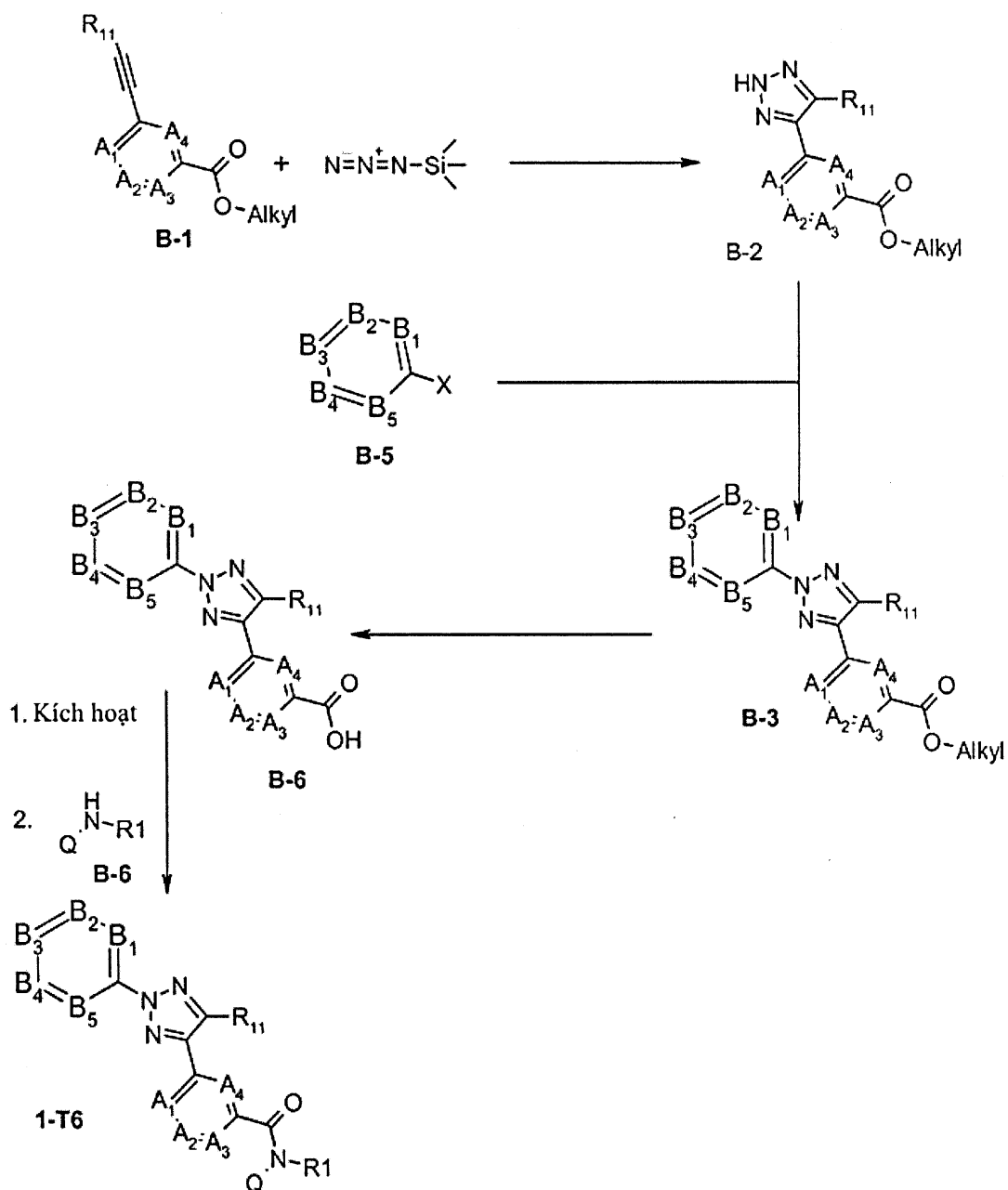
Các giai đoạn 4, 5: Quá trình thủy phân, amit hóa



Các hợp chất mới có công thức chung (I-T48) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp ghép mạch peptit đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu (A-4) và (A-8) [WO2010-051926; WO2010-133312]. Hợp chất có công thức chung (A-4) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu bằng quá trình thủy phân este từ hợp chất có công thức chung Z3 [WO2010-051926; WO2010-133312]. Các gốc A1-A4, B1-B5, alkyl, Q, R1 và R11 mỗi gốc như được xác định ở trên.

Hợp chất có công thức (I-T6) có thể được điều chế bằng quy trình được xác định trong sơ đồ phản ứng 2.

Sơ đồ phản ứng 2

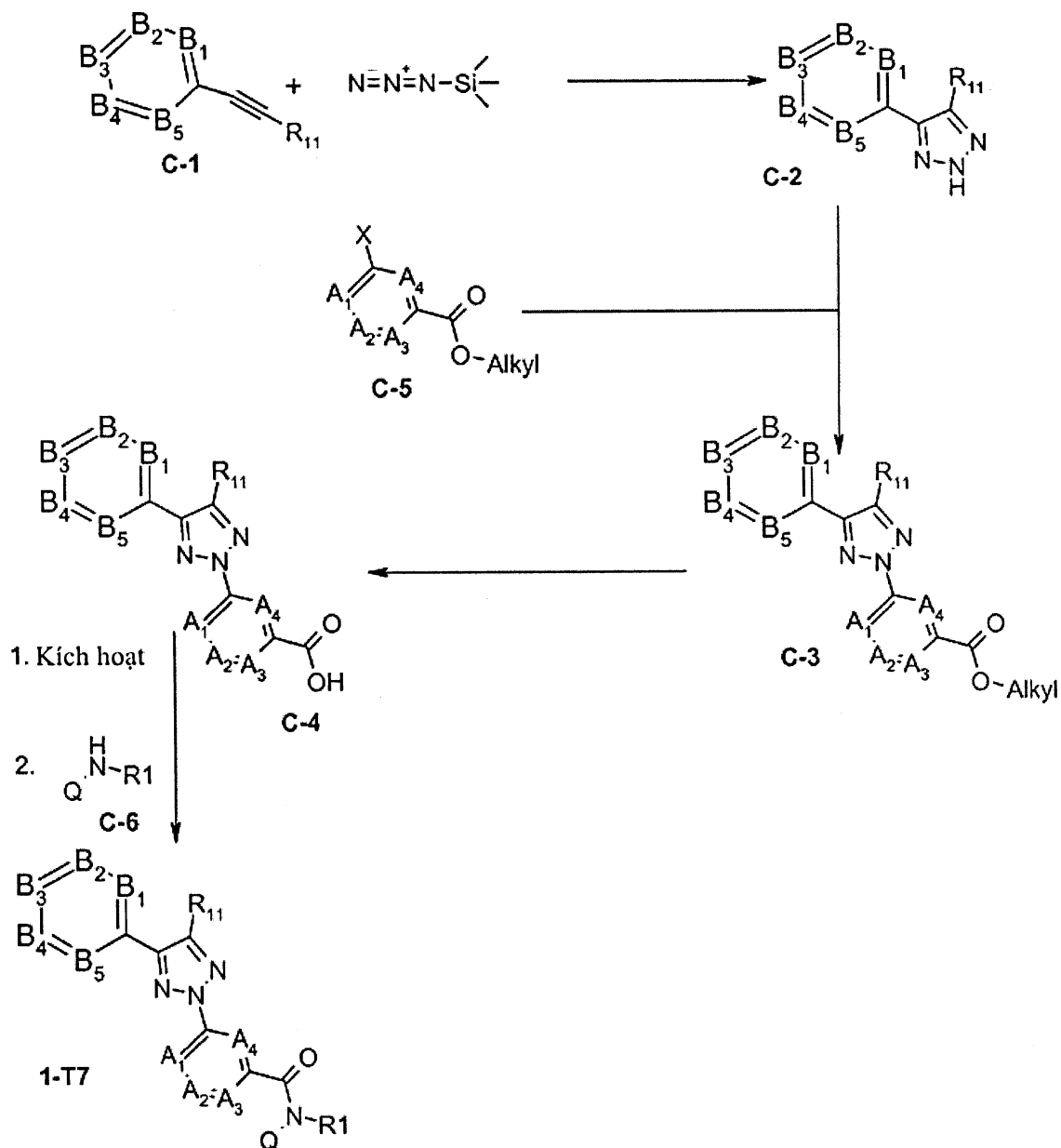


Các gốc $\text{A}_1\text{-A}_4$, $\text{B}_1\text{-B}_5$, alkyl, Q, R^1 và R^{11} mỗi gốc như được xác định ở trên. X là Cl, Br, I hoặc triflat. Các hợp chất khởi đầu có công thức (B-1) và (B-5) là đã biết ((B-1), ví dụ, WO 2012/175474, page 117-118; (B-5), ví dụ, US 5,739,083 page 10, US 2003/187233A1, page 6) hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Hợp chất có công thức chung (B2) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp đóng vòng đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (B-1) (ví dụ, WO 2013072825A1, p. 40). Hợp chất có công thức chung (B-3) có thể được điều chế tương

tự như các phương pháp liên hợp đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (B-2) và có công thức chung (B-5) (ví dụ, Ueda, Satoshi; Su, Mingjuan; Buchwald, Stephen L. *Angewandte Chemie, International Edition*, 50 (2011) 8944-8947; Yan, Wuming; Wang, Qiaoyi; Petersen, Jeffrey L.; Shi, Xiaodong; Lin, Quan; Li, Minyong *Chemistry-A European Journal*, 17 (2011) 5011-5018;). Hợp chất có công thức chung (B-4) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu bằng quá trình thủy phân este từ hợp chất có công thức chung (B-3) (WO 2010/051926; WO 2010/133312). Các hợp chất mới có công thức chung (I-T6) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp ghép mạch peptit đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu (B-4) và (B-6) (WO 2010/051926; WO 2010/133312).

Hợp chất có công thức (I-T7) có thể được điều chế bằng quy trình được xác định trong sơ đồ phản ứng 3.

Sơ đồ phản ứng 3

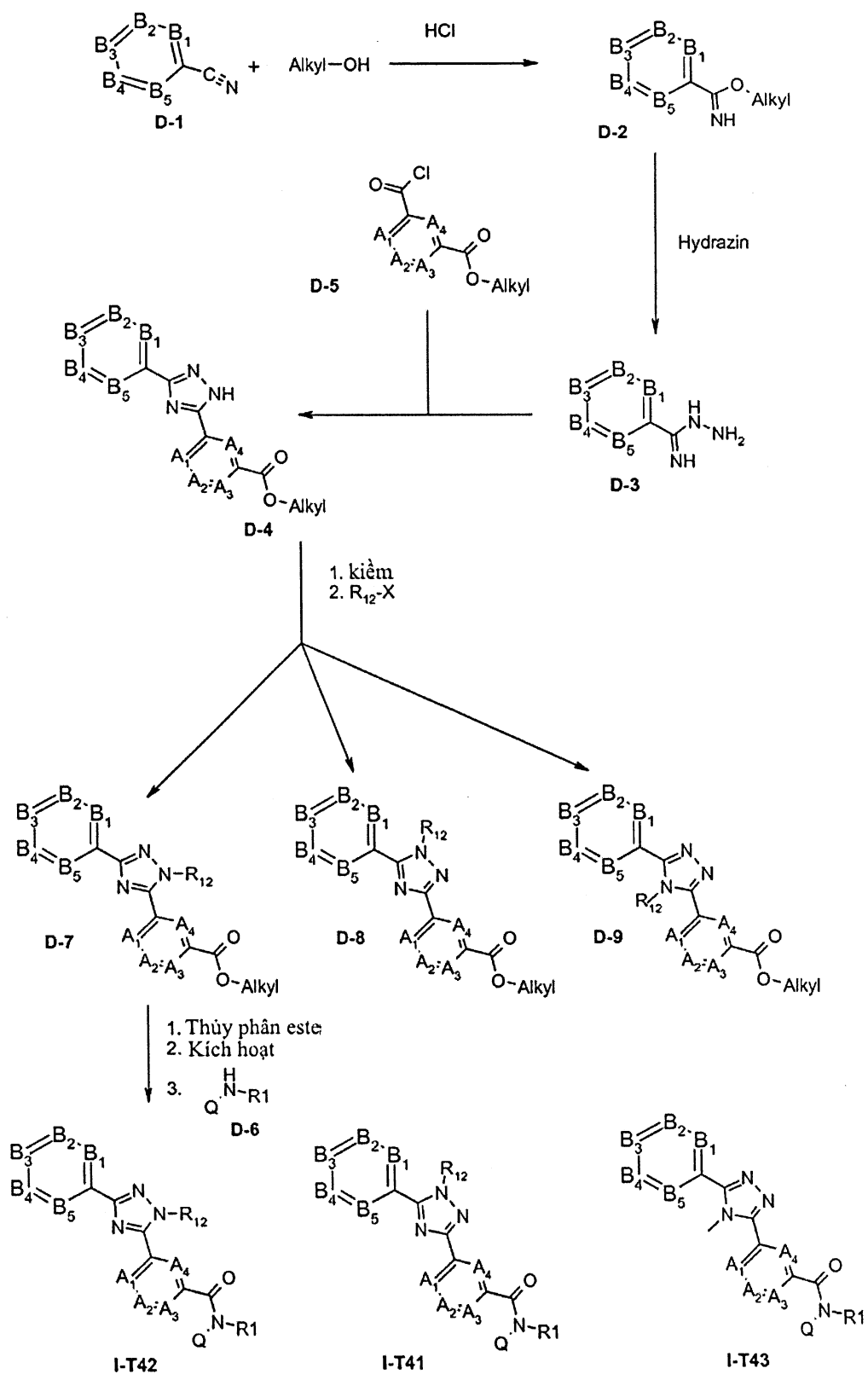


Các gốc A_1-A_4 , B_1-B_5 , alkyl, Q, R^1 và R^{11} mỗi một gốc như được xác định ở trên. X là Cl, Br, I hoặc triflat. Việc tổng hợp các hợp chất khởi đầu có công thức chung (C-1) đã được mô tả ở trên. Hợp chất khởi đầu có công thức chung (C-5) là đã biết (ví dụ, WO2004/99146, p. 68-69) hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Hợp chất có công thức chung (C-2) có thể được điều chế tương tự như phương pháp đóng vòng đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (C-1) (ví dụ, WO 2013/072825, p. 40). Hợp chất có công thức chung (C-3) có thể được điều chế tương

tự như phương pháp liên hợp đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (C-2) và có công thức chung (C-5) (ví dụ, Ueda, Satoshi; Su, Mingjuan; Buchwald, Stephen L. *Angewandte Chemie, International Edition*, 50 (2011) 8944-8947; Yan, Wuming; Wang, Qiaoyi; Petersen, Jeffrey L.; Shi, Xiaodong; Lin, Quan; Li, Minyong *Chemistry-A European Journal*, 17 (2011) 5011-5018). Hợp chất có công thức chung (C-4) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu bằng quá trình thủy phân este từ hợp chất có công thức chung (C-3) (WO 2010/051926; WO 2010/133312). Các hợp chất mới có công thức chung (I-T7) có thể được điều chế tương tự như phương pháp ghép mạch peptit đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu (C-4) và (C-6) (WO 2010/051926; WO 2010/133312).

Các hợp chất có công thức (I-T41), (I-T42) và (I-T43) có thể được điều chế bằng quy trình được xác định trong sơ đồ phản ứng 4.

Sơ đồ phản ứng 4

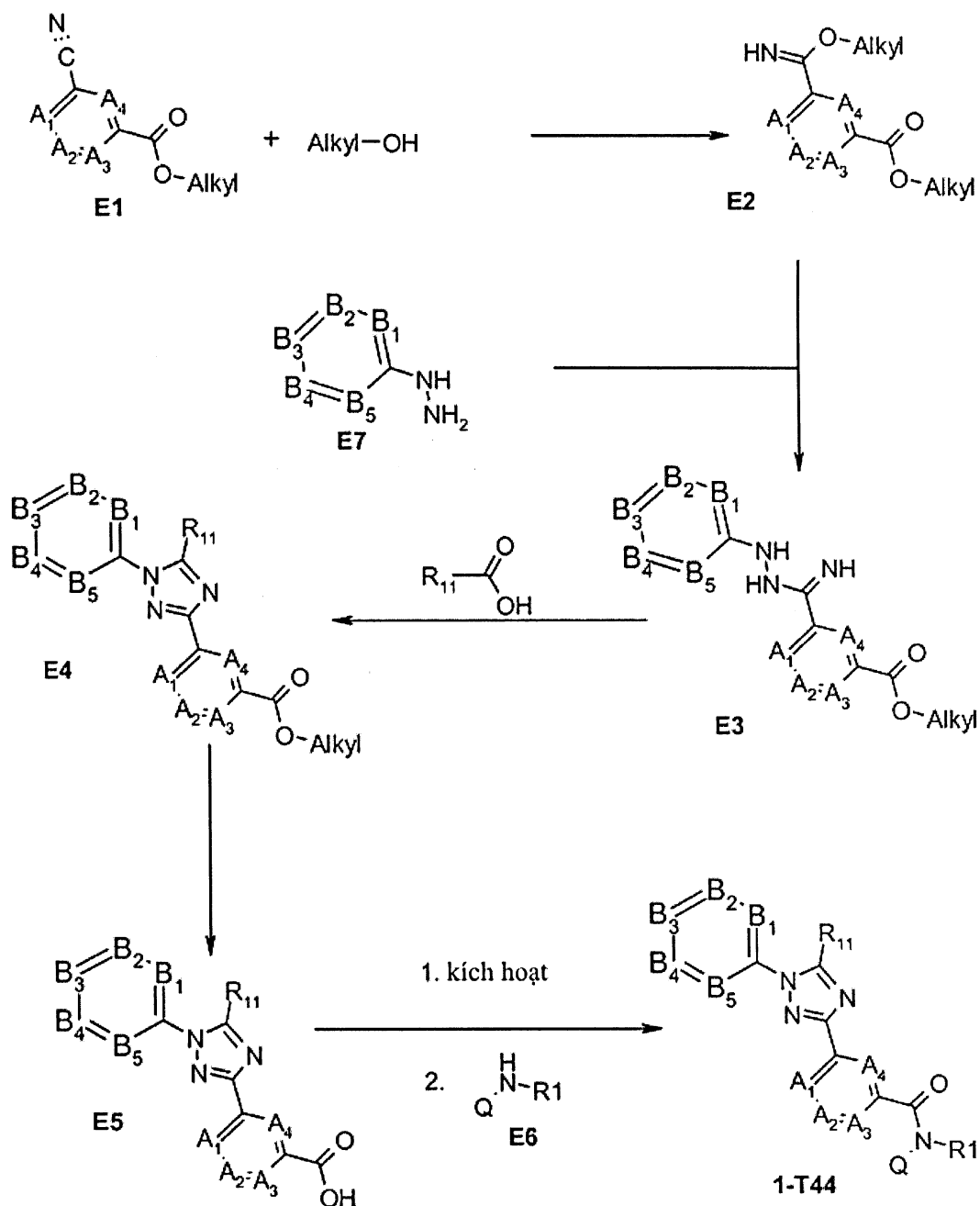


Các gốc A_1-A_4 , B_1-B_5 , alkyl, Q, R^1 và R^{12} mỗi một gốc như được xác định ở trên.

X là Cl, Br, I hoặc triflat. Các hợp chất khởi đầu có công thức (D-1) và (D-5) là đã biết ((D-1), ví dụ, US 2012/0302610, p. 55; (D-5), ví dụ, BE 639732, p. 3) hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Hợp chất có công thức chung (D-2) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (D-1) (ví dụ, WO 2008/71404, p. 31, Example 5d). Hợp chất có công thức chung (D-4) có thể được điều chế tương tự như phương pháp liên hợp đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (D-2) và có công thức chung (D-5) thông qua hợp chất trung gian (D-3). Quy trình có thể được thực hiện ở dạng phản ứng một bình (ví dụ, EP 1 405 636, p. 37, Example 36). Các hợp chất có công thức chung (D-7), (D-8) và (D-9) có thể thu được từ hợp chất có công thức chung (D-4) bằng quá trình alkyl hóa. Hợp chất có công thức chung (B-4) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu bằng quá trình thủy phân este từ hợp chất có công thức chung (B-3) (WO 2010/051926; WO 2010/133312). Các hợp chất mới có công thức chung (I-T41), (I-T42) và (I-T43) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu về thủy phân este (WO 2010/051926; WO 2010/133312) và sử dụng phương pháp liên hợp peptit sau đó đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu (D-7), (D-8) và (D-9) (WO 2010/051926; WO 2010/133312).

Hợp chất có công thức (I-T44) có thể được điều chế bằng quy trình được xác định trong sơ đồ phản ứng 5.

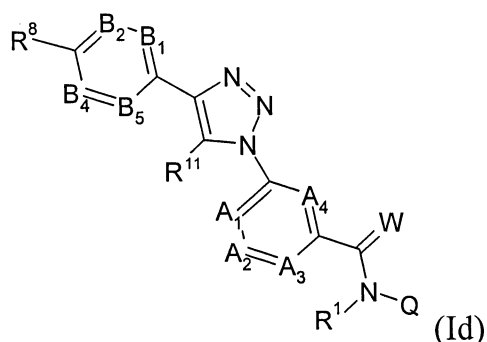
Sơ đồ phản ứng 5



Các gốc $\text{A}_1\text{-A}_4$, $\text{B}_1\text{-B}_5$, alkyl, Q, R^1 và R^{11} mỗi một gốc như được xác định ở trên. Hợp chất khởi đầu có công thức chung (E-1) là đã biết (ví dụ, EP 1 719 767 p. 41, hợp chất 73) hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Hợp chất khởi đầu có công thức chung (E-7) là đã biết hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết. Các ví dụ bao gồm [2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]hydrazin, [3-clo-5-(triflometyl)-2-pyridyl]hydrazin, [2,6-diclo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]

phenyl]hydrazin, [2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]hydrazin, [2-metyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]hydrazin, [2-clo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]hydrazin. Các hợp chất nêu trên có thể được điều chế, ví dụ, bằng các phương pháp được mô tả trong tài liệu US2003187233, page 13. Hợp chất có công thức chung (E-2) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (E-1) (ví dụ, WO 2008/71404, p. 31, Example 5d; US 2008/0280869, p. 101 [0775]). Hợp chất có công thức chung (E-3) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu từ hợp chất có công thức chung (E-2) và có công thức chung (E-7) (ví dụ, US 2008/0280869, p. 101 [0776]). Hợp chất có công thức chung (E-4) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đóng vòng đã biết trong tài liệu từ hợp chất (E-3) và axit cacboxylic đã biết trong tài liệu (ví dụ, US 2008/0280869, p. 101 [0777]). Hợp chất có công thức chung (E-5) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong tài liệu về thủy phân este từ hợp chất có công thức chung (E-4) (WO 2010/051926; WO 2010/133312). Các hợp chất mới có công thức chung (I-T44) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp ghép mạch peptit đã biết trong tài liệu từ nguyên liệu khởi đầu (E-5) và (E-6) (WO 2010/051926; WO 2010/133312).

Một phương án đặc biệt ưu tiên đề cập đến hợp chất có công thức (Id)



trong đó:

Q là xyclopropyl, 1-xyanoxyclopropyl, C₁-C₄-alkyl flo hóa (như CH₂CF₃), hoặc thietanyl (như thietan-3-yl);

R¹ là H;

R¹¹ là H;

mỗi gốc A^1 và A^4 là C-H;

A^2 là C-H hoặc N;

A^3 là C-Cl, C-F, C-I hoặc C-Br, tốt hơn là C-Cl;

W là O;

R^8 là C_1 - C_4 -alkyl flo hóa, tốt hơn là C_1 - C_4 -alkyl perflo hóa, như propyl perflo hóa, tốt hơn nữa là isopropyl perflo hóa (i- C_3F_7);

mỗi gốc B2 và B4 là C-H;

B^1 là C-(C_1 - C_4 -alkyl), C-F, C-Cl, C-I hoặc C-Br, tốt hơn là C- CH_3 hoặc C-Cl; và

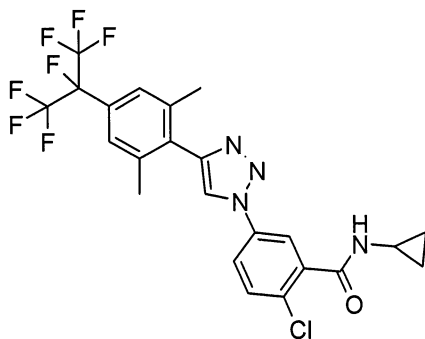
B^5 là C-(C_1 - C_4 -alkyl), C-F, C-Cl, C-I hoặc C-Br, tốt hơn là C- CH_3 hoặc C-Cl. mỗi gốc B1 và B5 tốt hơn nữa là C-(C_1 - C_4 -alkyl) hoặc mỗi gốc là C-F, hoặc mỗi gốc là C-Cl, hoặc mỗi gốc là C-I, hoặc mỗi gốc là C-Br; tốt nhất mỗi gốc này là C- CH_3 hoặc mỗi gốc này là C-Cl.

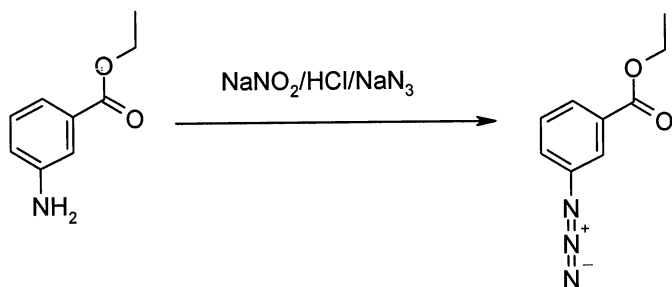
Ví dụ thực hiện sáng chế

Thực nghiệm

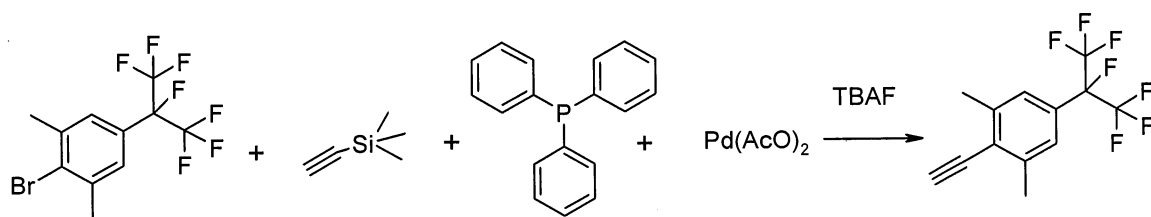
Quy trình điều chế I-T48-1

Ví dụ I-T48-1:



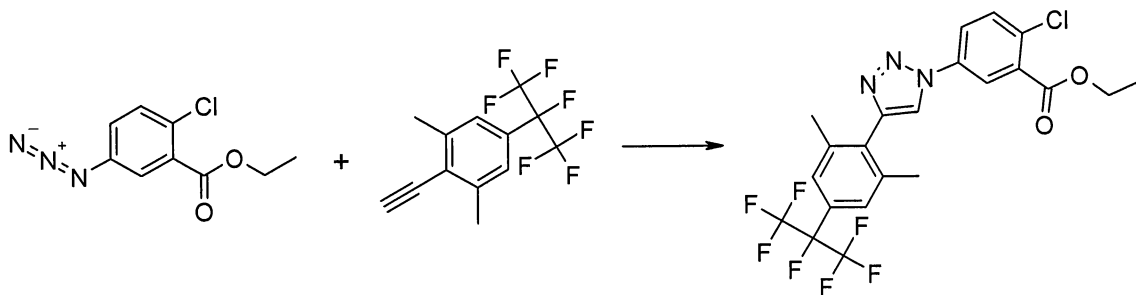


1,46g (7,31mmol) của ethyl 5-amino-2-cobenzoat được hòa tan trong 15ml axeton và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C, và 2,5ml axit clohydric đậm đặc được bổ sung từng giọt vào hỗn hợp. Sau đó, ở nhiệt độ 0°C, dung dịch chứa 555mg (8,04mmol) natri nitrit trong 3ml H₂O được bổ sung từng giọt vào đó. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 0°C trong thời gian 10 phút nữa, sau đó dung dịch chứa 408mg (4,97mmol) natri axetat trong 5ml nước được bổ sung ở nhiệt độ thấp hơn 5°C và sau đó dung dịch chứa 475mg (7,31mmol) natri azit trong 3ml nước được bổ sung từng giọt vào hỗn hợp. Sau đó, loại bỏ phương tiện làm lạnh và hỗn hợp được khuấy cho tới khi kết thúc sự thoát khí. Để xử lý, hỗn hợp được rót vào nước và được chiết bằng ethyl axetat. Phần dịch chiết được làm khô bằng natri sulphat và được cô trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay trong điều kiện áp suất giảm ở nhiệt độ bề bằng 30°C. Lượng 2,23g ethyl 5-azido-2-cobenzoat thu được, lượng này vẫn còn chứa một chút ethyl axetat.

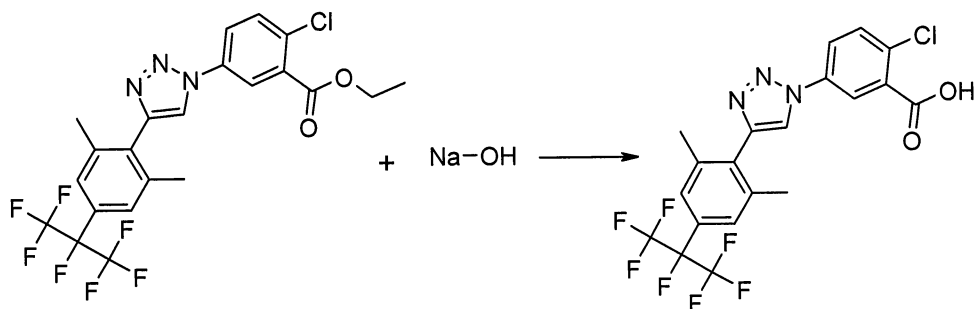


2,3g (6,51mmol) hợp chất 2-bromo-1,3-dimetyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflo-metyl)etyl]benzen được kết hợp với 1,037g (10,5mmol) etynyltrimetylsilan, 35mg (0,15mmol) paladi(II) axetat và 68mg (0,26mmol) triphenylphosphin trong 17ml trietylamin khô, và hỗn hợp được gia nhiệt tới nhiệt độ hồi lưu trong thời gian qua đêm trong điều kiện khí argon. Để xử lý, lượng trietylamin dư được loại bỏ trong điều kiện áp suất giảm trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay ở nhiệt độ bề bằng 30°C, phần cặn còn lại được trộn kết hợp với 40ml dung dịch nước natri hydrocacbonat bão hòa và hỗn

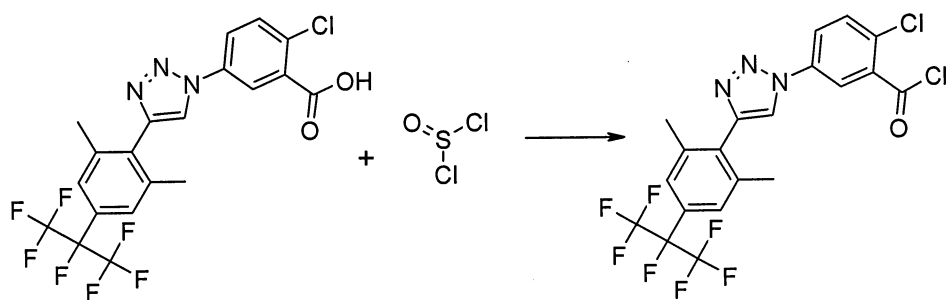
hợp được chiết ba lần bằng 24ml diclometan mỗi lần. Các phần dịch chiết kết hợp được làm khô bằng natri sulphat và được cô. Bổ sung 18ml tetrahydrofuran và 2,3ml (2,3mmol) dung dịch 1M chứa tetrabutylamoni florua trong tetrahydrofuran vào phần cặn còn lại. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 15 phút, sau đó được lọc bằng cách hút qua thủy tinh hút được nạp silicagel và được rửa sạch bằng etyl axetat. Phần dịch lọc được cô trong điều kiện áp suất giảm trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay ở nhiệt độ bề bằng 30°C. Sau đó, phần cặn còn lại được tiến hành sắc ký sử dụng 40g silicagel với tỷ lệ 90:10 (thể tích/thể tích) xyclohexan/etyl axetat làm dung môi rửa giải. 667mg hợp chất 2-etylnyl-1,3-dimetyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen thu được.



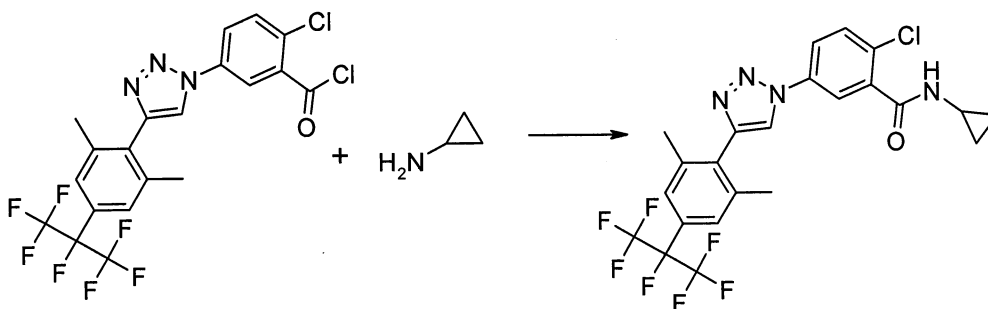
400mg (1,77mmol) etyl 5-azido-2-clobenzoat đầu tiên được nạp vào trong hỗn hợp của 5ml nước và 5ml tert-butanol. Sau đó, 529mg (1,77mmol) 2-etylnyl-1,3-dimetyl-5-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]benzen, 105mg (0,53mmol) dung dịch natri ascorbat và 13mg (0,053mmol) đồng(II) sulphat pentahydrat được bổ sung vào đó. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 3 giờ, sau đó được pha loãng bằng 10ml nước và được chiết bằng diclometan. Phần dịch chiết được làm khô bằng natri sulphat và dung môi được loại bỏ trong điều kiện áp suất giảm trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Sau đó, để tinh chế, phần cặn còn lại được tiến hành sắc ký sử dụng khay chứa 40g silicagel và gradient dung môi trong xyclohexan/etyl axetat theo tỷ lệ từ 90:10 (thể tích/thể tích) đến 70:30 (thể tích/thể tích). Thu được 280mg etyl 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoat.



345mg (0,659mmol) metyl 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflo-metyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoat đầu tiên được nạp vào trong 35ml metanol, và 0,79ml (0,79mmol) dung dịch 1M natri hydroxit được bổ sung vào đó. Hỗn hợp được gia nhiệt tới nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 3 giờ. Bước này được tiếp theo bằng bước cô và phân chia phần cặn còn lại thành axit clohydric loãng và etyl axetat. Pha hữu cơ được loại bỏ và pha nước được chiết hai lần nữa bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch nước natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulphat và được cô trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay trong điều kiện áp suất giảm. Phần cặn còn lại thu được là 350mg axit 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoic.



350mg (0,76mmol) axit 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflo-metyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoic được hòa tan trong 4,2ml toluen, và 420mg (3,53mmol) thionyl clorua được bổ sung vào đó. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt tới nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 2 giờ và sau đó, được cô trong điều kiện áp suất giảm trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Phần cặn còn lại thu được là 350mg 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoyl clorua.



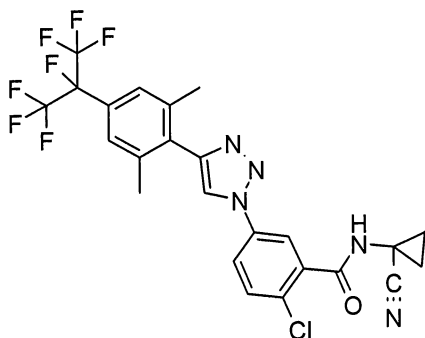
150mg (0,292mmol) 2-clo-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflo-metyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzoyl clorua được hòa tan trong 1,5ml diclometan và được bổ sung từng giọt ở nhiệt độ 0°C vào dung dịch chứa 42mg (0,729mmol) xyclopropylamin trong 1,5ml diclometan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 2 giờ và sau đó, được rót vào dung dịch nước natri dihydro phosphat 5%. Pha hữu cơ được loại bỏ, được rửa một lần bằng dung dịch nước natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulphat và được cô. Phần cặn còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký trên 15g silicagel với gradien bằng xyclohexan/etyl axetat nằm trong khoảng từ 90:10 đến 50:50 (thể tích/thể tích). Phần còn lại thu được là 115mg 2-clo-N-xyclopropyl-5-[4-[2,6-dimetyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]triazol-1-yl]benzamid (hợp chất **I-T48-1**).

HPLC-MS^a): logP = 4,19, khối lượng (m/z) = 535 [M+H]⁺.

¹H NMR (400 MHz, d₃-axetonitril): δ = 8,39 (s, 1 H), 7,92-7,95 (m, 2 H), 7,66 (d, J₁=8,5 Hz, 1H), 7,48 (s, 1 H), 7,07 (s (vạch rộng), 1 H (N-H)), 2,84-2,87 (m, 1H), 2,25 (s, 6 H), 0,76-0,8 (m, 2 H), 0,61-0,62 (m, 2 H).

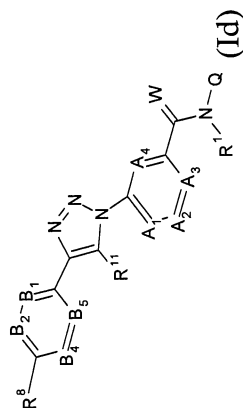
Tương tự như các phương pháp trong ví dụ I-T48-1, hợp chất sau được điều chế:

Ví dụ I-T48-2:



HPLC-MS^a): logP = 4,10, khối lượng (m/z) = 560 [M+H]⁺.

¹H NMR (400 MHz, d₃-axetonitril): δ = 8,40 (s, 1 H), 7,98-8,01 (m, 2 H), 7,80 (s (vạch rộng), 1 H (N-H)), 7,70 (d, J₁=8,7 Hz, 1H), 7,48 (s, 1 H), 2,25 (m, 1H), 1,55-1,60 (m, 2 H), 1,35-1,38 (m, 2 H).



¹⁾ Khối lượng thông báo là đỉnh của biểu đồ đồng vị của ion $[M+H]^+$ có cường độ cao nhất; nếu như ion $[M-H]^-$ được phát hiện, thì khối lượng thông báo được nhận diện bằng ².

² Khối lượng thông báo là đỉnh của biểu đồ đồng vị của ion $[M-H]^-$ có cường độ cao nhất.

a) Lưu ý về việc xác định các giá trị logP và phát hiện khối: Các giá trị logP được xác định theo tiêu chuẩn EEC Directive 79/831 Annex V.A8 bằng phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao (HPLC - high-performance liquid chromatography) trên cột pha đảo (C18) của hệ Agilent 1100 LC; 50*4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 micron; dung môi rửa giải A: axetonitril (axit formic 0,1%); dung môi rửa giải B: nước (axit formic 0,09%); gradient tuyến tính từ axetonitril 10% đến axetonitril 95% trong thời gian 4,25 phút, sau đó là axetonitril 95% trong thời gian 1,25 phút nữa; nhiệt độ lò 55°C; tốc độ dòng: 2,0ml/phút. Việc dò khối được thực hiện nhờ hệ thống Agilent MSD.

Dữ liệu NMR của các ví dụ lựa chọn

Dữ liệu 1H NMR của các ví dụ lựa chọn được thông báo ở dạng danh sách liệt kê đỉnh 1H NMR. Đối với mỗi một đỉnh tín hiệu, trước tiên, giá trị δ tính bằng ppm và sau đó, cường độ tín hiệu nằm trong dấu ngoặc đơn được liệt kê. Giá trị δ – các cặp số cường độ tín hiệu của các cặp tín hiệu khác nhau được liệt kê với việc phân cách nhau bằng dấu chấm phẩy.

Do đó, danh sách đỉnh của một ví dụ có dạng:

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

Cường độ của các tín hiệu rõ nét tương ứng với độ cao của các tín hiệu trong ví dụ được in ra của phổ NMR tính bằng cm và thể hiện các tỷ lệ thực của các cường độ tín hiệu. Trong trường hợp tín hiệu rộng, một số đỉnh hoặc giá trị trung bình của cường độ tín hiệu và cường độ tương đối của nó có thể được thể hiện so sánh với tín hiệu cường độ mạnh nhất trong phổ.

Để hiệu chỉnh sự chuyển vị hóa học của các phổ 1H NMR, tác giả sáng chế sử dụng tetrametylsilan và/hoặc sự chuyển vị hóa học của dung môi, nhất là trong trường hợp các phổ được đo trong DMSO. Do đó, đỉnh tetrametylsilan có thể nhưng không

nhất thiết xuất hiện trong các danh sách liệt kê đỉnh NMR.

Các danh sách liệt kê đỉnh ^1H NMR là tương tự như dữ liệu ^1H NMR in ra thông thường và do đó thường chứa tất cả các đỉnh được liệt kê trong các cách diễn giải NMR thông thường.

Ngoài ra, giống như dữ liệu ^1H NMR in ra thông thường, các danh sách nêu trên có thể thể hiện các tín hiệu về dung môi, các tín hiệu về chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích, tương tự cấu thành một phần nội dung của sáng chế, và/hoặc các đỉnh của tạp chất.

Khi thông báo về các tín hiệu của hợp chất nằm trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, danh sách liệt kê các đỉnh ^1H NMR ở đây thể hiện các đỉnh dung môi thông thường, ví dụ các đỉnh của DMSO trong DMSO- D_6 và đỉnh của nước, trung bình đỉnh này thông thường có cường độ cao.

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

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc tạp chất như vậy có thể là điển hình trong quy trình điều chế cụ thể. Do đó, trong trường hợp này, các đỉnh có thể giúp để nhận diện sự mô phỏng sao chép quy trình điều chế của tác giả sáng chế bằng việc tham chiếu "các dấu ấn sản phẩm phụ".

Chuyên gia tính toán đỉnh của các hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, nhưng cũng bằng các giá trị kỳ vọng đánh giá theo kinh nghiệm) nếu cần thiết, có thể tách riêng đỉnh của các hợp chất đích, tùy ý sử dụng các bộ lọc cường độ bổ sung. Sự tách riêng này có thể sẽ tương tự như việc chọn đỉnh thích hợp trong cách diễn giải ^1H NMR thông thường.

Các chi tiết khác về danh sách đỉnh ^1H NMR có thể được tìm thấy trong tài liệu Research Disclosure Database Number 564025.

Ví dụ I-T48-1 : $^1\text{H-NMR}$ (601,6 MHz, CD_3CN):

$\delta = 8,385$ (4,8); $7,953$ (1,8); $7,949$ (3,5); $7,946$ (2,6); $7,941$ (0,9); $7,931$ (2,1); $7,927$ (1,5); $7,668$ (2,6); $7,654$ (2,4); $7,480$ (4,8); $7,073$ (0,4); $2,873$ (0,6); $2,867$ (0,8); $2,861$ (1,3); $2,855$ (1,2); $2,849$ (0,8); $2,843$ (0,6); $2,259$ (1,1); $2,252$ (25,5); $2,181$ (4,9); $2,178$ (5,6); $2,176$ (6,0); $2,173$ (5,5); $2,169$ (5,9); $2,166$ (5,2); $1,966$ (0,4); $1,958$ (1,2); $1,954$ (1,4); $1,950$ (8,0); $1,946$ (14,0); $1,942$ (20,3); $1,938$ (13,5); $1,934$ (6,7); $1,436$ (16,0); $0,798$ (0,6); $0,789$ (1,8); $0,786$ (2,4); $0,778$ (2,5); $0,774$ (1,9); $0,766$ (0,8); $0,623$ (0,8); $0,615$ (1,9); $0,612$ (2,0); $0,608$ (1,8); $0,605$ (1,9); $0,597$ (0,6); $0,005$ (0,9); $0,000$ (29,6); $-0,006$ (1,0)

Ví dụ I-T48-2: $^1\text{H-NMR}$ (601,6 MHz, CD_3CN):

$\delta = 19,952$ (0,5); $8,399$ (16,0); $8,018$ (6,1); $8,014$ (8,7); $8,001$ (5,2); $7,997$ (3,2); $7,987$ (5,3); $7,982$ (4,1); $7,801$ (1,4); $7,706$ (8,0); $7,691$ (7,2); $7,482$ (14,5); $2,359$ (0,5); $2,254$ (72,9); $2,195$ (45,7); $2,188$ (56,7); $2,185$ (44,6); $2,184$ (48,4); $2,181$ (81,2); $2,179$ (45,4); $2,146$ (0,4); $2,053$ (0,5); $1,973$ (0,6); $1,967$ (1,9); $1,959$ (5,1); $1,954$ (6,1); $1,951$ (32,7); $1,946$ (56,6); $1,942$ (82,3); $1,938$ (55,6); $1,934$ (28,0); $1,828$ (0,5); $1,603$ (3,4); $1,594$ (8,8); $1,589$ (8,7); $1,580$ (4,2); $1,553$ (0,5); $1,436$ (4,8); $1,406$ (0,4); $1,379$ (4,3); $1,370$ (8,5); $1,365$ (9,1); $1,356$ (3,4); $0,097$ (0,4); $0,005$ (3,1); $0,000$ (96,9); $-0,006$ (3,8); $-0,101$ (0,3)

Ví dụ I-T48-3: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, CD_3CN):

$\delta = 8,579$ (0,5); $8,565$ (10,6); $7,956$ (3,8); $7,949$ (12,6); $7,928$ (4,6); $7,922$ (3,1); $7,843$ (16,0); $7,687$ (0,6); $7,680$ (5,0); $7,678$ (5,1); $7,658$ (4,5); $7,065$ (1,5); $5,448$ (0,5); $2,890$ (0,4); $2,880$ (1,2); $2,871$ (1,8); $2,862$ (2,6); $2,853$ (2,7); $2,844$ (1,8); $2,835$ (1,2); $2,825$ (0,4); $2,164$ (50,1); $2,114$ (0,4); $2,108$ (0,4); $1,965$ (1,9); $1,959$ (4,9); $1,953$ (25,6); $1,947$ (46,9); $1,941$ (63,2); $1,935$ (44,3); $1,929$ (23,2); $1,769$ (0,4); $1,436$ (6,1); $1,269$ (0,5); $0,806$ (1,4); $0,793$ (4,4); $0,788$ (5,9); $0,775$ (6,1); $0,770$ (4,5); $0,758$ (2,0); $0,630$ (1,9); $0,618$ (5,3); $0,613$ (5,7); $0,609$ (5,1); $0,603$ (4,8); $0,591$ (1,4); $0,146$ (0,4); $0,008$ (2,9); $0,000$ (83,6); $-0,008$ (4,3); $-0,150$ (0,4)

Ví dụ I-T48-4: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, CD_3CN):

$\delta = 8,577$ (10,6); $8,018$ (4,6); $8,011$ (7,8); $8,003$ (5,0); $7,996$ (2,5); $7,982$ (4,3); $7,975$ (3,3); $7,844$ (16,0); $7,770$ (1,5); $7,714$ (6,3); $7,693$ (5,5); $5,448$ (3,8); $2,786$ (0,4);

2,164 (35,0); 2,109 (0,4); 1,972 (1,1); 1,965 (1,6); 1,959 (4,0); 1,953 (18,9); 1,947 (34,5); 1,941 (46,5); 1,935 (33,9); 1,929 (18,8); 1,607 (2,8); 1,592 (7,7); 1,585 (7,9); 1,572 (4,1); 1,532 (0,5); 1,436 (2,3); 1,426 (0,6); 1,386 (3,9); 1,372 (8,0); 1,365 (8,3); 1,350 (3,1); 1,268 (0,7); 1,221 (0,3); 1,204 (0,5); 0,008 (2,7); 0,000 (55,8)

Ví dụ I-T48-5: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, CD_3CN):

$\delta = 8,403$ (13,3); 8,014 (4,7); 8,013 (4,7); 8,008 (10,2); 8,005 (9,1); 7,982 (4,5); 7,977 (3,7); 7,726 (6,7); 7,705 (5,8); 7,526 (2,1); 7,482 (16,0); 5,449 (3,6); 5,448 (3,7); 4,161 (1,5); 4,144 (2,0); 4,137 (4,8); 4,121 (5,0); 4,114 (5,4); 4,097 (4,7); 4,091 (2,5); 4,074 (1,6); 3,361 (0,9); 2,463 (1,0); 2,460 (0,9); 2,437 (0,7); 2,415 (0,5); 2,257 (68,9); 2,160 (226,0); 2,122 (1,2); 2,115 (1,3); 2,109 (1,5); 2,103 (1,1); 2,097 (1,0); 1,964 (7,3); 1,954 (68,1); 1,953 (72,5); 1,948 (129,1); 1,947 (130,5); 1,942 (179,5); 1,940 (173,6); 1,936 (143,6); 1,930 (84,2); 1,781 (0,5); 1,775 (0,8); 1,769 (1,1); 1,764 (0,9); 1,758 (0,5); 1,438 (0,5); 1,270 (0,7); 0,237 (0,7); 0,147 (1,0); 0,001 (192,8); 0,000 (199,3); -0,149 (1,1)

Ví dụ I-T48-6: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, CD_3CN):

$\delta = 8,396$ (8,2); 7,997 (3,5); 7,991 (5,1); 7,971 (3,0); 7,965 (1,8); 7,950 (3,2); 7,943 (2,5); 7,696 (4,6); 7,674 (3,9); 7,621 (0,7); 7,481 (7,6); 5,448 (3,3); 5,342 (1,0); 5,320 (2,0); 5,300 (2,0); 5,279 (1,1); 4,086 (1,0); 4,068 (3,0); 4,050 (3,1); 4,032 (1,0); 3,554 (2,8); 3,550 (1,7); 3,530 (5,0); 3,511 (2,0); 3,508 (3,6); 3,379 (3,7); 3,375 (2,2); 3,359 (5,1); 3,355 (4,7); 3,338 (1,5); 3,335 (2,7); 2,463 (0,4); 2,257 (41,9); 2,163 (53,8); 2,114 (0,4); 2,108 (0,5); 2,101 (0,4); 2,095 (0,4); 1,972 (13,7); 1,964 (2,6); 1,958 (5,9); 1,953 (33,4); 1,946 (60,6); 1,940 (81,8); 1,934 (56,5); 1,928 (29,3); 1,775 (0,3); 1,769 (0,5); 1,763 (0,3); 1,437 (16,0); 1,221 (3,7); 1,204 (7,4); 1,186 (3,7); 0,146 (0,5); 0,008 (4,0); 0,000 (121,2); -0,009 (4,7); -0,150 (0,5)

Ví dụ I T48 7: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $d_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,15$ (0,1263); 9,14 (0,1329); 9,11 (0,2764); 9,06 (0,0239); 8,81 (0,0568); 8,80 (0,0599); 8,54 (0,1355); 8,53 (0,1358); 7,50 (0,1932); 2,88 (0,0228); 2,87 (0,0370); 2,86 (0,0399); 2,85 (0,0258); 2,84 (0,0210); 2,54 (0,8060); 2,29 (0,0342); 2,27 (0,9003); 0,78 (0,0248); 0,76 (0,0685); 0,76 (0,1051); 0,75 (0,0970); 0,74 (0,0893); 0,73 (0,0376); 0,59 (0,0320); 0,58 (0,0869); 0,58 (0,0960); 0,57 (0,0860); 0,57

(0,0899); 0,55 (0,0315); 0,14 (0,0869); 0,12 (0,2710); 0,01 (0,0294); 0,01 (0,0232); -0,01 (0,0366); -0,01 (0,0457); -0,01 (0,0193).

Ví dụ I T48 7: $^1\text{H-NMR}$ (400,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,72 (0,0420); 9,19 (0,0433); 9,18 (0,0454); 9,12 (0,0877); 8,65 (0,0445); 8,65 (0,0452); 7,50 (0,0653); 2,54 (0,8050); 2,27 (0,3018); 1,64 (0,0353); 1,63 (0,0413); 1,33 (0,0350); 1,33 (0,0419); 0,13 (0,0233); 0,12 (0,0656); 0,01 (0,0310); 0,00 (1,0000); -0,01 (0,0534).

Ví dụ sinh học

Boophilus microplus – thử nghiệm tiêm (BBOMI Inj)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dung môi và sản phẩm cô được pha loãng bằng dung môi tới nồng độ mong muốn.

1 μl dung dịch hoạt chất được tiêm vào trong bụng của 5 con tích gia súc cái trưởng thành hút căng máu (*Boophilus microplus*). Động vật được chuyển vào trong các đĩa và được duy trì trong phòng được kiểm soát môi trường.

Hiệu quả được đánh giá sau thời gian 7 ngày bằng cách cho đẻ trứng hữu thụ. Các trứng mà hiển nhiên không hữu thụ được bảo quản trong ngăn được kiểm soát môi trường cho tới khi ấu trùng nở sau thời gian khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% có nghĩa là, không có con tích nào đẻ bất kỳ trứng hữu thụ nào; 0% có nghĩa là, tất cả các trứng đều là hữu thụ.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 4 μg /động vật: I-T48-1, I-T48-2.

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống (CTECFE)

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Nhằm mục đích tạo ra công thức phối chế hoạt chất thích hợp, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimetyl sulphoxit. Tiến hành pha loãng bằng máu gia súc

được xitrat hóa thu được nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 bọ chết mèo không được cho ăn (*Ctenocephalides felis*) được đặt vào trong một khoang nhỏ mà khoang này được đậy kín ở đỉnh và đáy bằng gạc. Một cột hình trụ bằng kim loại mà đáy của nó được đậy kín bằng màng parafilm được đặt lên trên khoang nêu trên. Cột trụ chứa máu/chế phẩm hoạt tính, có thể được hấp thụ bởi bọ chết thông qua màng parafilm.

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, tất cả số bọ chết đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có bọ chết nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 20 ppm: I-T48-1, I-T48-2.

Thử nghiệm trên ruồi *Lucilia cuprina* (LUCICU)

Dung môi: dimethyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimethyl sulphoxit, và sản phẩm cô được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 ấu trùng L1 của ruồi hút máu cừu châu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào trong bình thử nghiệm chứa thịt ngựa thái nhỏ và chế phẩm hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ấu trùng nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 20 ppm: I-T48-1, I-T48-2.

Thử nghiệm trên ruồi nhà *Musca domestica* (MUSCDO)

Dung môi: dimethyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimethyl sulphoxit, và sản phẩm cô được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Các bình chứa bột biển được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm hoạt

chất ở nồng độ mong muốn được đưa vào trong đó bằng 10 ruồi hút máu ngựa trưởng thành (*Musca domestica*).

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ruồi đã bị tiêu diệt hoặc bị hạ gục; 0% có nghĩa là, không có ruồi nào bị tiêu diệt hoặc bị hạ gục.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 20 ppm: I-T48-1, I-48-2.

Điều chế dung dịch hoạt chất và nguyên liệu phủ ống thử nghiệm trong các thử nghiệm tiếp xúc

Đối với nguyên liệu phủ ống thử nghiệm, 9mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250µl dung dịch được phân bố đồng đều trên các thành bên trong và đáy của ống thử nghiệm (lọ thủy tinh nhỏ thể tích 25ml (Fisher Scientific, Order No. 320 55 60) bằng cách xoay và lắc trên thiết bị lắc mẫu “Rock ‘n’ Roller” (Model L202, Labinc; quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong một nắp đậy khối trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7cm², có thể đạt được sự phân bố đồng đều xác định, liều lượng dựa vào diện tích 5µg/cm².

Thử nghiệm tiếp xúc *Ctenocephalides felis* in vitro với bọ chét (CTECFE)

Các ví dụ điều chế của hợp chất theo sáng chế được thể halogen có công thức (I) được thử nghiệm về hiệu quả tiếp xúc của chúng với côn trùng ngoại ký sinh (ở đây là bọ chét mèo). Đối với mục đích này, các lọ thủy tinh nhỏ được phủ bằng 250µl dung dịch axeton chứa hoạt chất như mô tả ở trên. Sau khi dung môi đã bay hơi hết, các ống thử nghiệm được đưa vào bằng 5 đến 10 bọ chét (loại *Ctenocephalides felis* trưởng thành), đậy kín bằng nắp nhựa đục lỗ và được ủ ở vị trí nằm ngang ở nhiệt độ trong phòng và độ ẩm môi trường xung quanh. Sau thời gian 48 giờ, hiệu quả (bị hạ gục và bị tiêu diệt) và tỷ lệ chết được xác định. Về điểm này, các ống thử nghiệm được để thẳng đứng và bọ chét bị hạ gục xuống đáy ống. Những bọ chét mà nằm bất động ở

đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối được coi là bị chết hoặc bị hạ gục (hấp hối).

Chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu như đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$. Tỷ lệ chết 100% có nghĩa là, toàn bộ bọ chết đã bị tiêu diệt, hiệu quả 100% có nghĩa là, toàn bộ bọ chết bị hấp hối (bị hạ gục) hoặc chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là, không có bọ chết nào bị tổn thương.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng $1\mu\text{g}/\text{cm}^2$: I-T48-1, I-48-2.

Thử nghiệm tiếp xúc *Ctenocephalides felis* in vitro với bọ chết mèo trưởng thành

Đối với nguyên liệu phủ ống thử nghiệm, 9mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 μl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống thử nghiệm thể tích 25ml bằng cách xoay và lắc trên máy lắc tròn (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7 cm^2 , có thể đạt được sự phân bố đồng đều xác định, liều lượng dựa vào diện tích $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$.

Sau khi dung môi đã bay hơi hết, các ống được cho vào băng 5 đến 10 bọ chết mèo trưởng thành (*Ctenocephalides felis*), đây kín bằng nắp nhựa đục lỗ và được ủ ở vị trí nằm ngang ở nhiệt độ trong phòng và độ ẩm môi trường xung quanh. Sau thời gian 48 giờ, hiệu quả được xác định. Về điểm này, các ống thử nghiệm được để thẳng đứng và bọ chết bị hạ gục xuống đáy ống. Những bọ chết mà nằm bất động ở đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối được coi là bị chết hoặc hấp hối.

Chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu như ít nhất đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$. Hiệu quả 100% có nghĩa là, toàn bộ bọ chết bị chết hoặc hấp hối. Hiệu quả 0% có nghĩa là, không có bọ chết nào bị tổn thương.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4.

Thử nghiệm tiếp xúc *Rhipicephalus sanguineus* in vitro với tích chó nâu (RHIPSA)

Các ví dụ điều chế của hợp chất theo sáng chế được thể halogen có công thức (I) được thử nghiệm về hiệu quả tiếp xúc của chúng với lớp nhện ngoại ký sinh (ở đây là tích chó nâu). Đối với mục đích này, các lọ thủy tinh nhỏ được phủ bằng 250 μ l dung dịch axeton chứa hoạt chất như mô tả ở trên. Sau khi dung môi đã bay hơi hết, các ống được đưa vào bằng 5 đến 10 con tích (loài *Rhipicephalus sanguineus* trưởng thành), đậy kín bằng nắp nhựa đục lỗ và được ủ ở vị trí nằm ngang trong bóng tối ở nhiệt độ trong phòng và độ ẩm môi trường xung quanh. Sau thời gian 48 giờ, hiệu quả (bị hạ gục và bị tiêu diệt) và tỷ lệ chết được xác định. Về điểm này, các con tích bị hạ gục xống đáy ống nghiệm và được ủ trên tấm hâm nóng ở nhiệt độ 45-50°C trong thời gian không lâu hơn 5 phút. Các tích mà nằm bất động trên đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối khiến cho chúng không có khả năng chú ý tránh được nhiệt nóng bằng cách leo lên phía trên được coi là bị chết hoặc bị hạ gục (hấp hối).

Chất thể hiện hiệu quả chống lại *Rhipicephalus sanguineus* tốt nếu như đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5 μ g/cm².

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 80% với tỷ lệ áp dụng 1 μ g/cm²: I-48-2.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 1 μ g/cm²: I-48-1.

Thử nghiệm tiếp xúc *Rhipicephalus sanguineus* in vitro với tích chó nâu trưởng thành

Đối với nguyên liệu phủ ống thử nghiệm, 9mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 μ l dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống thử nghiệm thể tích 25ml bằng cách xoay và lắc trên máy lắc tròn (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7cm², có thể đạt được sự phân bố đồng đều xác định, liều lượng dựa vào diện tích 5 μ g/cm².

Sau khi dung môi đã bay hơi hết, các ống nghiệm được đưa vào bằng 5 đến 10 tích chó trưởng thành (*Rhipicephalus sanguineus*), đậy kín bằng nắp nhựa đục lỗ và

được ủ ở vị trí nằm ngang trong bóng tối ở nhiệt độ trong phòng và độ ẩm môi trường xung quanh. Sau thời gian 48 giờ, hiệu quả được xác định. Về điểm này, những con tích bị hạ gục xuống đất ống và được ủ trên tấm hâm nóng ở nhiệt độ 45-50°C trong thời gian không lâu hơn 5 phút. Những con tích mà nằm bất động trên đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối khiến cho chúng không có khả năng chủ động tránh nhiệt nóng bằng cách leo lên phía trên được coi là bị chết hoặc hấp hối.

Chất thể hiện hiệu quả chống lại *Rhipicephalus sanguineus* tốt nếu như ít nhất đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm². Hiệu quả 100% có nghĩa là, toàn bộ tích bị chết hoặc hấp hối. Hiệu quả 0% có nghĩa là, không có tích nào bị tổn thương.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm²: I-T48-1, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-7

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 80% với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm²: I-T48-2

Thử nghiệm với *Amblyomma hebraeum*

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimetyl sulfoxit, và sản phẩm cô được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Nhộng tích (*Amblyomma hebraeum*) được đặt vào trong cốc nhựa đục lỗ và được ngâm trong nồng độ mong muốn trong thời gian 1 phút. Tích được chuyển qua giấy lọc để vào đĩa Petri và được bảo quản trong ngăn được kiểm soát môi trường.

Sau thời gian 42 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ tích đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có con tích nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-1, I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-3

Thử nghiệm ngâm nhúng *Boophilus microplus*

Động vật thử nghiệm: tích gia súc (*Boophilus microplus*) chủng Parkhurst, kháng SP

Dung môi: dimetyl sulphoxit

10mg hoạt chất được hòa tan trong 0,5ml dimetyl sulphoxit. Đối với mục đích tạo ra công thức phối chế thích hợp, dung dịch hoạt chất được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn trong mỗi trường hợp.

Công thức phối chế hoạt chất này được chuẩn độ bằng pipet vào trong ống nghiệm. 8 đến 10 tích gia súc cái trưởng thành hút căng máu (*Boophilus microplus*) được chuyển vào trong một ống khác có lỗ. Các ống được nhúng vào trong công thức phối chế hoạt chất và toàn bộ tích được làm ướt hoàn toàn. Sau khi chất lỏng đã khô hết, tích được chuyển qua các đĩa lọc vào trong đĩa nhựa và được bảo quản trong phòng được kiểm soát môi trường.

Hiệu quả được đánh giá sau thời gian 7 ngày bằng cách cho đẻ trứng hữu thụ. Các trứng mà hiển nhiên không hữu thụ được bảo quản trong ngăn được kiểm soát môi trường cho tới khi ấu trùng nở sau thời gian khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% có nghĩa là, không có con tích nào đẻ bất kỳ trứng hữu thụ nào; 0% có nghĩa là, tất cả các trứng đều là hữu thụ.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-1, I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-3

Boophilus microplus – thử nghiệm tiêm

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dung môi và sản phẩm cô được pha loãng bằng dung môi tới nồng độ mong muốn.

1µl dung dịch hoạt chất được tiêm vào trong bụng của 5 con tích gia súc cái

trưởng thành hút căng máu (*Boophilus microplus*). Động vật được chuyển vào trong các đĩa và được duy trì trong phòng được kiểm soát môi trường.

Hiệu quả được đánh giá sau thời gian 7 ngày bằng cách cho đẻ trứng hữu thụ. Các trứng mà hiển nhiên không hữu thụ được bảo quản trong ngăn được kiểm soát môi trường cho tới khi ấu trùng nở sau thời gian khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% có nghĩa là, không có con tích nào đẻ bất kỳ trứng hữu thụ nào; 0% có nghĩa là, tất cả các trứng đều là hữu thụ.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 20µg/động vật: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6, I-T48-7, I-T48-8

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Nhằm mục đích tạo ra công thức phối chế hoạt chất thích hợp, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimetyl sulphoxit. Tiến hành pha loãng bằng máu gia súc được xitrat hóa thu được nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 bọ chết mèo không được cho ăn (*Ctenocephalides felis*) được đặt vào trong một khoang nhỏ mà khoang này được đậy kín ở đỉnh và đáy bằng gạc. Một cột hình trụ bằng kim loại mà đáy của nó được đậy kín bằng màng parafilm được đặt lên trên khoang nêu trên. Cột trụ chứa máu/chế phẩm hoạt tính, có thể được hấp thụ bởi bọ chết thông qua màng parafilm.

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, tất cả số bọ chết đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có bọ chết nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6, I-T48-7, I-T48-8

Thử nghiệm với *Lucilia cuprina*

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với

0,5ml dimetyl sulphoxit, và sản phẩm cô được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 ấu trùng L1 của ruồi hút máu cừu châu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào trong bình thử nghiệm chứa thịt ngựa thái nhỏ và chế phẩm hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ấu trùng nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6, I-T48-7

Thử nghiệm với ruồi nhà *Musca domestica*

Dung môi: dimetyl sulphoxit

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 10mg hoạt chất được trộn kết hợp với 0,5ml dimetyl sulphoxit, và sản phẩm cô được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Các bình chứa bột biển được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm hoạt chất ở nồng độ mong muốn được đưa vào trong đó bằng 10 ruồi hút máu ngựa trưởng thành (*Musca domestica*).

Sau thời gian 2 ngày, tỷ lệ tiêu diệt tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ruồi đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ruồi nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100 ppm: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6, I-T48-7

Myzus persicae – thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần theo khối lượng của axeton

1,5 phần theo khối lượng của dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 1 phần theo khối lượng của hoạt chất được hòa tan sử dụng các phần riêng biệt theo khối lượng của dung môi và được đưa vào nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để sản xuất các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) gây nhiễm bởi rệp đào (*Myzus persicae*) ở tất cả các giai đoạn được phun bằng công thức phối chế hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 6 ngày, hiệu quả tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 500g/ha: I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100g/ha: I-T48-1, I-T48-2

Phaedon cochleariae – thử nghiệm phun

Dung môi:	78,0 phần theo khối lượng của axeton
	1,5 phần theo khối lượng của dimethylformamit
Chất nhũ hóa:	alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 1 phần theo khối lượng của hoạt chất được hòa tan sử dụng các phần riêng biệt theo khối lượng của dung môi và được đưa vào nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để sản xuất các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) được phun bằng công thức phối chế hoạt chất ở nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, được đưa vào bằng các ấu trùng của bọ cánh cứng mù tạc (*Phaedon cochleariae*).

Sau thời gian 7 ngày, hiệu quả tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng bọ cánh cứng đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ấu trùng bọ

cánh cứng nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 500g/ha: I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100g/ha: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6

Spodoptera frugiperda – thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần theo khối lượng của axeton

1,5 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 1 phần theo khối lượng của hoạt chất được hòa tan sử dụng các phần riêng biệt theo khối lượng của dung môi và được đưa vào nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để sản xuất các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá ngô (*Zea mays*) được phun bằng công thức phối chế hoạt chất ở nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, được đưa vào ngài sâu xanh (*Spodoptera frugiperda*).

Sau thời gian 7 ngày, hiệu quả tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ngài đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có ngài nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 500g/ha: I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100g/ha: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-5, I-T48-6

Tetranychus urticae – thử nghiệm phun, kháng OP

Dung môi: 78,0 phần theo khối lượng của axeton

1,5 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, 1 phần theo khối lượng của hoạt chất được hòa tan sử dụng các phần riêng biệt theo khối lượng của dung môi và được đưa vào nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để sản xuất các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá đậu (*Phaseolus vulgaris*) gây nhiễm bằng mật nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) ở tất cả mọi giai đoạn được phun bằng công thức phối chế hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian 6 ngày, hiệu quả tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ mật nhện đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có mật nhện nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 500g/ha: I-T48-7, I-T48-8

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 100g/ha: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-3, I-T48-4, I-T48-6

Thử nghiệm với muỗi anopheles (xử lý bề mặt ANPHFU)

Dung môi: axeton + 2000 ppm methyl este dầu cải dầu (RME)

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, hoạt chất được hòa tan trong dung môi (2mg/ml). Chế phẩm hoạt chất được hút bằng pipet lên gạch men và sau khi đã làm khô, muỗi trưởng thành thuộc loài *Anopheles funestus* chủng FUMOS-R (Hunt et al., Med Vet Entomol. 2005 Sep; 19(3):271-5) được đặt lên gạch đã xử lý. Thời gian tiếp xúc là 30 phút.

24 giờ sau khi tiếp xúc với bề mặt đã xử lý, tỷ lệ chết tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ muỗi đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có muỗi nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện

hiệu quả từ 90 đến 100% với tỷ lệ áp dụng 100mg/m²: I-T48-1

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả từ 90 đến 100% với tỷ lệ áp dụng 20mg/m²: I-T-48-4

Thử nghiệm trên muỗi Aedes (xử lý bề mặt AEDSAE)

Dung môi: axeton + 2000 ppm metyl este dầu cải dầu (RME)

Để tạo ra công thức phối chế hoạt chất, hoạt chất được hòa tan trong dung môi (2mg/ml). Chế phẩm hoạt chất được hút bằng pipet lên gạch men và sau khi đã làm khô, các muỗi trưởng thành thuộc loài *Aedes aegypti* chủng MONHEIM được đặt lên gạch đã xử lý. Thời gian tiếp xúc là 30 phút.

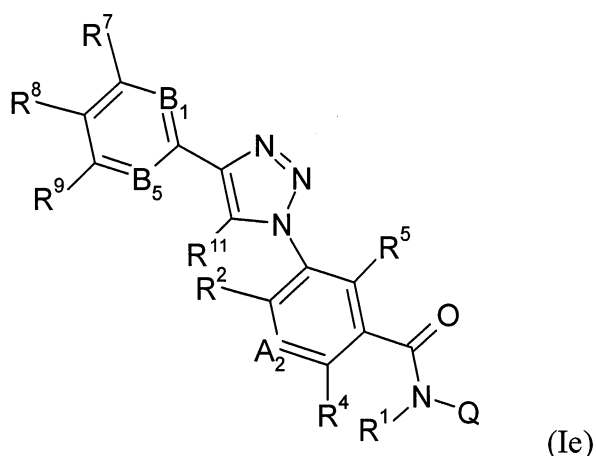
24 giờ sau khi tiếp xúc với bề mặt đã xử lý, tỷ lệ chết tính bằng % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ muỗi đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có muỗi nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả từ 90 đến 100% với tỷ lệ áp dụng 100mg/m²: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-4

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả từ 90 đến 100% với tỷ lệ áp dụng 20mg/m²: I-T48-1, I-T48-2, I-T48-4

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (Ie):



trong đó:

R¹ là H, trong mỗi trường hợp là C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₇-xycloalkyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, aryl(C₁-C₃)-alkyl, heteroaryl(C₁-C₃)-alkyl được thể tùy ý,

các gốc tiếp theo là như sau:

A_2 là CR^3 hoặc N ,

B_1 là CR^6 hoặc N ,

B_5 là CR^{10} hoặc N ,

mỗi gốc R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹ và R¹⁰ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, *N*-C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₃-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfanyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, *N*-C₁-C₆-alkylamino hoặc *N,N*-di-C₁-C₆-alkylamino được thể tùy ý;

nếu gốc A₂ không là N, thì R³ và R⁴ cùng với nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng có 5 hoặc 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nitơ và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử oxy và/hoặc 0 hoặc 1 nguyên tử lưu huỳnh, hoặc R² và R³ cùng với

nguyên tử cacbon liên kết với các gốc này có thể tạo ra vòng 6 cạnh chứa 0, 1 hoặc 2 nguyên tử nito;

R^8 là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, N - C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, N - C_1 - C_6 -alkylamino hoặc N,N -di- C_1 - C_6 -alkylamino được thế tùy ý, tốt hơn là halogen hoặc C_1 - C_4 -alkyl được thế halogen;

Q là H, formyl, hydroxyl, amino hoặc trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_5 -heteroxycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkyl- C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, C_6 -, C_{10} -, C_{14} -aryl, C_1 - C_5 -heteroaryl, C_6 -, C_{10} -, C_{14} -aryl- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_5 -heteroaryl- C_1 - C_3 -alkyl, N - C_1 - C_4 -alkylamino, N - C_1 - C_4 -alkylcarbonylamino, hoặc N,N -di- C_1 - C_4 -alkylamino được thế tùy ý; hoặc

là vòng cacbon 6 cạnh không no tùy ý được thế poly-V; hoặc

là vòng dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh không no tùy ý được thế poly-V, trong đó:

V độc lập là halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -alkenyl, C_1 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, N - C_1 - C_6 -alkoxyimino- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfanyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, hoặc N,N -di-(C_1 - C_6 -alkyl)amino được thế tùy ý;

R^{11} là H, halogen, xyano, nitro, amino hoặc trong mỗi trường hợp là C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkyloxy, C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -alkylsufanyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được thế tùy ý, tốt hơn là H,

và cả muối, N-oxit và các dạng hỗn biến của hợp chất có công thức (Ie).

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó R^{11} là H.

3. Hợp chất theo điểm 1 hoặc 2, trong đó mỗi gốc R^6 , R^7 , R^9 và R^{10} độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_4 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, N -alkoxyiminoalkyl, C_1 - C_4 -alkylsulfanyl, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, N - C_1 - C_4 -alkylamino, N,N -di- C_1 - C_4 -alkylamino được thế tùy ý.

4. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó mỗi gốc R^2 , R^3 , R^4

và R^5 độc lập là H, halogen, xyano, nitro, trong mỗi trường hợp là C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_4 -xycloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, N - C_1 - C_4 -alkoxyimino- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylsulfanyl, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, N - C_1 - C_4 -alkylamino hoặc N,N -di- C_1 - C_4 -alkylamino được thế tùy ý.

5. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó R^1 là H.

6. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 5, trong đó Q là C_1 - C_4 -alkyl được thế flo, C_3 - C_4 -xycloalkyl, C_3 - C_4 -xycloalkyl tùy ý được thế xyano hoặc được thế flo, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, benzyl, pyridin-2-ylmetyl, metylsulphonyl hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamin)etyl.

7. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 6, trong đó Q là 2,2,2-trifloetyl, 2,2-difloetyl, 3,3,3-triflopropyl, xyclopropyl, xyclobutyl, 1-xyanoxycyclopropyl, trans-2-floxycyclopropyl hoặc cis-2-floxycyclopropyl, oxetan-3-yl, thietan-3-yl, 1-oxidothietan-3-yl, 1,1-dioxidothietan-3-yl, benzyl, pyridin-2-ylmetyl, metylsulphonyl hoặc 2-oxo-2-(2,2,2-trifloetylamin)etyl.

8. Hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7, trong đó R^8 là halogen hoặc C_1 - C_4 -alkyl được thế halogen.

9. Chế phẩm diệt côn trùng, khác biệt ở chỗ, chế phẩm này chứa ít nhất một hợp chất có công thức (Ie) theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8 và chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt.

10. Phương pháp bảo vệ hạt chuyển gen hoặc hạt thông thường và thực vật mọc lên từ chúng khỏi bị nhiễm bởi sinh vật gây hại, khác biệt ở chỗ, bước xử lý hạt bằng ít nhất một hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8.

11. Hạt, trong đó hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8 được đưa lên hạt này ở dạng một thành phần của lớp phủ hoặc ở dạng một lớp khác hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ.