



(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)



1-0030019

(51)<sup>8</sup> C07D 401/06; C07D 403/06; C07D 471/04; C07D 409/06; C07D 413/06; C07D 417/06; C07D 207/277; C07D 405/06 (13) B

(21) 1-2017-04298

(22) 19/05/2016

(86) PCT/US2016/033231 19/05/2016

(87) WO2016/196019 08/12/2016

(30) 62/168,360 29/05/2015 US

(45) 25/11/2021 404

(43) 26/02/2018 359A

(73) FMC CORPORATION (US)

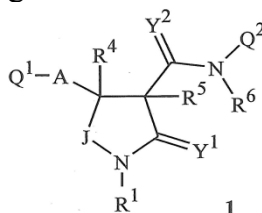
2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America

(72) CAMPBELL, Matthew James (US); SATTERFIELD, Andrew Duncan (US).

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

(54) HỢP CHẤT AMIT VÒNG ĐƯỢC THỂ LÀM THUỐC DIỆT CỎ, CHẾ PHẨM DIỆT CỎ CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ SỰ SINH TRƯỞNG CỦA THỰC VẬT KHÔNG MONG MUỐN

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức 1, bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể, N-oxit, và các muối của chúng:



trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, J, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, A, Y<sup>1</sup>, và Y<sup>2</sup> là như được xác định trong phần mô tả.

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm diệt cỏ chứa hợp chất có công thức 1 và phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn bao gồm bước cho thực vật không mong muốn hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế.

## Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

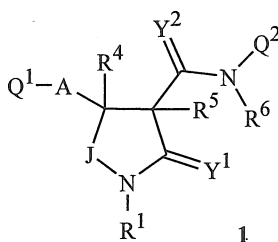
Sáng chế đề cập đến các hợp chất amit vòng nhất định, N-oxit và muối của chúng, và các chế phẩm và phương pháp sử dụng chúng để phòng trừ thực vật không mong muốn.

## Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Để đạt được năng suất thu hoạch cao thì việc phòng trừ thực vật không mong muốn là điều vô cùng quan trọng. Rất mong muốn đạt được mức phòng trừ chọn lọc sự sinh trưởng của cỏ dại, đặc biệt là cỏ dại mọc trong các cây trồng như lúa, đậu tương, củ cải đường, ngô, khoai tây, lúa mì, lúa mạch, cà chua và cây trồng đồn điền, trong số các cây trồng khác. Sự sinh trưởng ở cỏ dại không kiểm soát được mọc trong các cây trồng hữu ích này có thể làm giảm đáng kể năng suất và do đó dẫn đến việc làm tăng chi phí cho người tiêu dùng. Việc phòng trừ thực vật không mong muốn mọc trong các khu vực không trồng trọt cũng là rất quan trọng. Nhiều sản phẩm đáp ứng được các mục đích này hiện có bán trên thị trường, nhưng vẫn cần có các hợp chất mới có hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, độ độc thấp hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có các vị trí tác động khác nhau.

## Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể), bao gồm N-oxit và muối của chúng, chế phẩm nông dụng chứa chúng và sử dụng chúng làm thuốc diệt cỏ:



trong đó:

A là mạch bão hòa, chưa bão hòa một phần hoặc chưa bão hòa hoàn toàn chứa 1 đến 3 nguyên tử được chọn từ tối đa 3 nguyên tử cacbon tối đa 1 nguyên tử O, tối đa 1 nguyên tử S và tối đa 2 nguyên tử N, trong đó tối đa 2 thành phần cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và thành phần nguyên tử lưu huỳnh được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>; mạch nói trên tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>15</sup> trên nguyên tử cacbon và R<sup>16</sup> trên nguyên tử nitơ;

Q<sup>1</sup> là vòng phenyl hoặc hệ vòng naphtalenyl, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup>; hoặc vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này là các thành phần vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, trong đó tối đa 3 thành phần trong vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và thành phần vòng là nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> các thành phần vòng là nguyên tử cacbon và được chọn từ R<sup>9</sup> trên các thành phần vòng là nguyên tử nitơ;

Q<sup>2</sup> là vòng phenyl hoặc hệ vòng naphtalenyl, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>10</sup>; hoặc nhân dị vòng thơm có 5 đến 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này là các thành phần vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, trong đó tối đa 3 thành phần trong vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và thành phần vòng là nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>10</sup> trên các thành phần vòng là nguyên tử cacbon và được chọn từ R<sup>11</sup> trên các thành phần vòng là nguyên tử nitơ;

Y<sup>1</sup> và Y<sup>2</sup> độc lập là O, S hoặc NR<sup>12</sup>;

J là -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-; hoặc -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>-CR<sup>2a</sup>R<sup>3a</sup>-, trong đó nhóm -CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>- được liên kết trực tiếp với N;

R<sup>1</sup> là H, hydroxy, amino, xyano, formyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonylalkyl, -C(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl)=N-O(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl), -C(O)NH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> xyanoalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxycarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylaminoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc arylcarbonyl, arylalkenylalkyl, arylcarbonylalkyl hoặc -CPh=N-O(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl), mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>13</sup>; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi  $R^2$  và  $R^3$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1$ – $C_4$  alkyl,  $C_1$ – $C_4$  haloalkyl hoặc  $C_1$ – $C_4$  alkoxy; hoặc  
 $R^2$  và  $R^3$  cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo ra vòng  $C_3$ – $C_7$  xycloalkyl;  
mỗi  $R^{2a}$  và  $R^{3a}$  độc lập là H, halogen hoặc  $C_1$ – $C_4$  alkyl; hoặc  
 $R^{2a}$  và  $R^{3a}$  cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo ra vòng  $C_3$ – $C_7$  xycloalkyl;  
mỗi  $R^4$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1$ – $C_4$  alkoxy hoặc  $C_1$ – $C_4$  alkyl;  
mỗi  $R^5$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1$ – $C_4$  alkoxy, xyano hoặc  $C_1$ – $C_4$  alkyl;  
 $R^6$  là H, hydroxy, amino,  $C_1$ – $C_6$  alkyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_6$  alkenyl,  $C_3$ – $C_6$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkylcarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxycarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxycarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkoxycarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylaminocarbonyl,  $C_3$ – $C_{10}$  dialkylaminocarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylaminocarbonyl,  $C_1$ – $C_6$  alkoxy,  $C_1$ – $C_6$  alkylthio,  $C_1$ – $C_6$  haloalkylthio,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylthio,  $C_1$ – $C_6$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkylsulfinyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_6$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkylsulfonyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_6$  alkylaminosulfonyl,  $C_2$ – $C_8$  dialkylaminosulfonyl hoặc  $C_3$ – $C_{10}$  trialkylsilyl; hoặc  $G^1$ ;  
mỗi  $R^7$  độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro,  $C_1$ – $C_8$  alkyl,  $C_2$ – $C_8$  xyanoalkyl,  $C_1$ – $C_8$  xyanoalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkenyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkynyl,  $C_1$ – $C_8$  nitroalkyl,  $C_2$ – $C_8$  nitroalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  alkylxycloalkyl,  $C_1$ – $C_8$  alkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  alkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyloxy,  $C_3$ – $C_8$  alkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  haloalkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylthio,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylthio,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $C_1$ – $C_4$  alkylamino,  $C_2$ – $C_4$  dialkylamino, formylamino,  $C_2$ – $C_4$  alkylcarbonylamino,  $-SF_5$ ,  $-SCN$ ,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkoxy,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylthio,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylthio,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylthio,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkynyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyhaloalkyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkyl,  $C_3$ – $C_8$

haloxycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; hoặc G<sup>2</sup>; hoặc R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NO-, (R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>NN=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NNR<sup>20a</sup>-, R<sup>20</sup>N=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=N-, R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>C(R<sup>23b</sup>)<sub>2</sub>- hoặc (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NOC(R<sup>24a</sup>)<sub>2</sub>-, trong đó liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết với Q<sup>1</sup>; hoặc hai R<sup>7</sup> liên kề cùng với nguyên tử cacbon mà chúng liên kết vào tạo thành vòng C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> xycloalkyl;

mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloxycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> alkylxycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> dialkylamino, formylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonylamino, -SF<sub>5</sub>, -SCN, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkoxy, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyhaloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloxycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; hoặc G<sup>2</sup>; hoặc R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NO-, (R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>NN=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NNR<sup>20a</sup>-, R<sup>20</sup>N=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=N-, R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>C(R<sup>23b</sup>)<sub>2</sub>- hoặc (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NOC(R<sup>24a</sup>)<sub>2</sub>-, trong đó liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết với Q<sup>2</sup>; hoặc

hai R<sup>10</sup> liên kề cùng với nguyên tử cacbon mà chúng liên kết vào tạo thành vòng C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> xycloalkyl;

mỗi R<sup>8</sup> độc lập là H, xyano, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> alkylcarbonyl hoặc C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> haloalkylcarbonyl;

mỗi R<sup>9</sup> và R<sup>11</sup> độc lập là xyano, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> xycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>

- alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>3</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>3</sub> alkylaminoalkyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>4</sub> dialkylaminoalkyl;
- mỗi R<sup>12</sup> độc lập là H, xyano, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> haloalkoxy,  $-(C=O)CH_3$  hoặc  $-(C=O)CF_3$ ;
- mỗi G<sup>1</sup> độc lập là phenyl, phenylmetyl (tức là benzyl), pyridinylmetyl, phenylcarbonyl (tức là benzoyl), phenoxy, phenyletynyl, phenylsulfonyl, phenylcarbonylalkyl, 2-, 3- hoặc 4-pyridinyloxy hoặc vòng dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>13</sup>;
- mỗi G<sup>2</sup> độc lập là phenyl, phenylmetyl (tức là benzyl), pyridinylmetyl, phenylcarbonyl (tức là benzoyl), phenylcarbonylalkyl, phenoxy, phenyletynyl, phenylsulfonyl, 2-, 3- hoặc 4-pyridinyloxy hoặc vòng dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>14</sup>;
- mỗi R<sup>13</sup> và R<sup>14</sup> độc lập là halogen, xyano, hydroxy, amino, nitro,  $-CHO$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-SO_2NH_2$ , C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkoxy carbonyl, C<sub>5</sub>–C<sub>12</sub> xycloalkylalkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonylamino, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonylamino, phenyl, pyridinyl hoặc thienyl;
- mỗi R<sup>15</sup> độc lập là halogen, xyano, hydroxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> xycloalkyl hoặc C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl; hoặc
- hai nhóm R<sup>15</sup> cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng liên kết vào tạo thành vòng C<sub>3</sub>–C<sub>7</sub> xycloalkyl;
- mỗi R<sup>16</sup> độc lập là xyano, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> haloalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkoxy, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkoxy carbonyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> xycloalkyl;
- mỗi R<sup>17</sup> độc lập là H, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxy carbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl,

- C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;
- mỗi R<sup>17a</sup> độc lập là H, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylthio hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;
- mỗi R<sup>18</sup> độc lập là H, hydroxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxycarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;
- mỗi R<sup>19</sup> độc lập là H, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxycarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;
- mỗi R<sup>20</sup> độc lập là H, hydroxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxycarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi  $R^{20a}$  độc lập là H,  $C_1-C_6$  alkyl,  $C_3-C_8$  xycloalkyl,  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1-C_6$  haloalkyl,  $C_2-C_6$  alkenyl,  $C_3-C_6$  alkynyl,  $C_2-C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_1-C_6$  alkoxy hoặc  $C_3-C_{10}$  trialkylsilyl; hoặc  $G^1$ ;  
 mỗi  $R^{23b}$  độc lập là H, halogen, xyano, hydroxy,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_3-C_8$  xycloalkyl,  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl,  $C_1-C_4$  alkoxy,  $C_1-C_4$  haloalkoxy,  $C_2-C_4$  alkoxyalkyl,  $C_2-C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_4$  alkoxy carbonyl hoặc  $C_3-C_6$  xycloalkyl;  
 mỗi  $R^{24a}$  độc lập là H,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_3-C_8$  xycloalkyl,  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl,  $C_1-C_4$  alkoxy,  $C_1-C_4$  haloalkoxy,  $C_2-C_4$  alkoxyalkyl,  $C_2-C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_4$  alkoxy carbonyl hoặc  $C_3-C_6$  xycloalkyl; và  
 mỗi u và v độc lập là 0, 1 hoặc 2 trong mỗi trường hợp  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , với điều kiện tổng của u và v bằng 0, 1 hoặc 2;

với điều kiện khi A là nguyên tử S và  $Q^1$  là phenyl không được thế,  $Q^2$  không phải là phenyl không được thế.

Cụ thể hơn, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể), N-oxit hoặc muối của chúng. Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm diệt cỏ chứa hợp chất theo sáng chế (tức là với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ) và ít nhất một thành phần được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm thuốc diệt cỏ khác và chất an toàn diệt cỏ (safener). Sáng chế còn đề xuất phương pháp phòng trừ sự sinh trưởng của thực vật không mong muốn bao gồm bước cho thực vật hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả ở đây).

Sáng chế còn bao gồm hỗn hợp diệt cỏ chứa (a) hợp chất được chọn từ Công thức 1, N-oxit và muối của nó, và (b) ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ (b1) đến (b16); và muối của các hợp chất (b1) đến (b16), như được mô tả dưới đây.

### Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả này, các thuật ngữ "bao gồm", "chứa", "có", "khác biệt ở chỗ" hoặc các biến thể bất kỳ của chúng, được dự định bao hàm đối tượng, nội dung không mang tính loại trừ trong giới hạn bất kỳ được biểu thị một cách rõ ràng. Ví dụ, chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp bao gồm nhiều yếu tố thì nó không nhất thiết giới hạn chỉ ở các phần tử này mà có thể không được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có đối với chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp đó.

Cụm từ "chứa" không bao gồm yếu tố, bước hoặc thành phần bất kỳ không được nêu cụ thể. Nếu trong yêu cầu bảo hộ thì cụm từ này sẽ giới hạn yêu cầu bảo hộ ở các chất ngoài các chất được nêu ngoại trừ các tạp chất thường liên quan đến nó. Nếu cụm từ "chứa" xuất hiện trong mệnh đề của phần nội dung trong yêu cầu bảo hộ, chứ không

phải xuất hiện sau phần mở đầu, thì nó chỉ giới hạn yếu tố nêu trong mệnh đề đó; các yếu tố khác không bị loại trừ toàn bộ khỏi yêu cầu bảo hộ.

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

Khi Người nộp đơn xác định sáng chế hoặc một phần của nó bằng thuật ngữ có kết mở như “bao gồm”, cần phải hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả cũng là nhằm mô tả sáng chế bằng cách sử dụng các thuật ngữ “về cơ bản chứa” hoặc “chứa”.

Ngoài ra, trừ khi có quy định khác, “hoặc” được dùng để chỉ sự bao hàm và không phải là loại trừ. Ví dụ, điều kiện “A hoặc B” thỏa mãn một trường hợp trong số các trường hợp bất kỳ trong các trường hợp sau: A đúng (hoặc có mặt) và B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Hơn nữa, các mạo từ không xác định “một” đứng trước phần tử hoặc thành phần theo sáng chế được dự định dùng để chỉ một cách không giới hạn một số trường hợp (tức là biến) của phần tử hoặc thành phần này. Vì vậy “một” phải được hiểu là bao hàm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của phần tử hoặc thành phần này cũng bao hàm cả số nhiều trừ khi số này có nghĩa rõ ràng là số ít.

Như được đề cập trong bản mô tả này, thuật ngữ “nảy mầm”, được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp nghĩa là cây non phát triển từ phôi của hạt.

Như được đề cập trong bản mô tả này, thuật ngữ “lá rộng” được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “cỏ đại lá rộng” nghĩa là hai lá mầm hoặc cây hai lá mầm, thuật ngữ này được sử dụng để mô tả nhóm cây hạt kín, khác biệt ở chỗ phôi có hai lá mầm.

Trong các phần mô tả nêu trên, thuật ngữ “alkyl”, được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “alkylthio” hoặc “haloalkyl” bao gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metyl, etyl, *n*-propyl, *i*-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl, pentyl hoặc hexyl khác nhau. “Alkenyl” bao gồm alken mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, và các chất đồng phân khác nhau butenyl, pentenyl và hexenyl. “Alkenyl” cũng bao gồm polyen như 1,2-propadienyl và 2,4-hexadienyl. “Alkynyl” bao gồm alkyn mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl và các chất đồng phân butynyl, pentynyl và hexynyl khác nhau. Thuật ngữ “trialkylsilyl” tức là ba nhóm alkyl được gắn qua nguyên tử silic, với mỗi alkyl là giống nhau hoặc khác nhau.

“Alkoxy” bao gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy và các chất đồng phân butoxy, pentoxy và hexyloxy khác nhau. “Alkoxyalkyl” để chỉ việc thay thế alkoxy trên alkyl. Ví dụ về “alkoxyalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ . “Alkoxyalkoxy” là

sự thay thế alkoxy trên alkoxy. “Alkoxyalkoxyalkyl” dùng để chỉ sự thay thế alkoxy trên gốc alkoxy của gốc alkoxyalkyl. Ví dụ về “alkoxyalkoxyalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2-$  và  $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2-$ . “Alkenyloxy” bao gồm gốc alkenyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh. Ví dụ về “alkenyloxy” bao gồm  $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ ,  $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$  và  $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ . “Alkynyloxy” bao gồm gốc alkynyloxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh. Ví dụ về “alkynyloxy” bao gồm  $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ ,  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$  và  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ . “Alkylthio” bao gồm gốc alkylthio mạch nhánh hoặc mạch thẳng như metylthio, etylthio, và các chất đồng phân propylthio, butylthio, pentylthio và hexylthio khác nhau. “Alkylsulfinyl” bao gồm cả hai chất đồng phân đối ảnh của nhóm alkylsulfinyl. Ví dụ về “alkylsulfinyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$  và các chất đồng phân butylsulfinyl, pentylsulfinyl và hexylsulfinyl khác nhau. Ví dụ về “alkylsulfonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ , và các chất đồng phân butylsulfonyl, pentylsulfonyl và hexylsulfonyl khác nhau. Ví dụ về “alkylsulfonylamino” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{NH}-$ , và các chất đồng phân butylsulfonylamino, pentylsulfonylamino và hexylsulfonylamino khác nhau. Ví dụ về “alkylaminosulfonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{NHS}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHS}(\text{O})_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHS}(\text{O})_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHS}(\text{O})_2-$ , và các chất đồng phân butylsulfonylamino, pentylsulfonylamino và hexylsulfonylamino khác nhau. Ví dụ về “alkylsulfonyloxy” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{O}-$ , và các chất đồng phân butylsulfonyloxy, pentylsulfonyloxy và hexylsulfonyloxy khác nhau. “Alkylthioalkyl” dùng để chỉ sự thay thế alkylthio trên alkyl. Ví dụ về “alkylthioalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{SCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ . “Xyanoalkyl” chỉ nhóm alkyl được thế bằng một nhóm xyano. Ví dụ về “xyanoalkyl” bao gồm  $\text{NCCH}_2-$ ,  $\text{NCCH}_2\text{CH}_2-$  và  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2-$ . “Xyanoalkoxy” là nhóm alkoxy được thế bằng một nhóm xyano. Ví dụ về “xyanoalkoxy” bao gồm  $\text{NCCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{NCCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  và  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2\text{O}-$ . “Nitroalkenyl” là nhóm alkenyl được thế bằng một nhóm nitro. Ví dụ về “nitroalkenyl” bao gồm  $\text{O}_2\text{NCH}=\text{CH}-$ ,  $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$  và  $\text{CH}_2=\text{CH}(\text{NO}_2)\text{CH}_2-$ . “nitroalkyl” là nhóm alkyl được thế bằng một nhóm nitro. Ví dụ về “nitroalkyl” bao gồm  $\text{O}_2\text{NCH}_2-$ ,  $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}_2-$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}(\text{NO}_2)-$ . “Alkylsulfinylalkyl” dùng để chỉ sự thay thế alkylsulfinyl trên alkyl. Ví dụ về “alkylsulfinylalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ . “Alkylsulfonylalkyl” dùng để chỉ sự thay thế alkylsulfonyl trên alkyl. Ví dụ về “alkylsulfonylalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ . “Xylcoalkylthio” là nhóm xycloalkyl được liên kết qua nguyên tử lưu huỳnh. Ví dụ về “xycloalkylthio” bao gồm *c*-PrS-, *c*-BuS- và *c*-HexS-. “Xycloalkylsulfinyl” và “xycloalkylsulfonyl” được xác định tương tự như trên. “Alkylamino”, “đialkylamino”, và các nhóm tương tự, được xác định theo phương pháp tương tự với ví dụ nêu trên. Ví

dụ về “alkylaminoalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{NHCH}_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2-$  và  $\text{CH}_3\text{NHCH}(\text{CH}_3)-$ . Ví dụ về “alkylaminoalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{NHCH}_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2-$  và  $\text{CH}_3\text{NHCH}(\text{CH}_3)-$ . Ví dụ về “alkylaminocarbonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{NHC(O)}-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC(O)}-$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC(O)}-$ . Ví dụ về “dialkylaminoalkyl” bao gồm  $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{CH}_3)\text{H}-$  và  $(\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{NCH}_2-$ . Ví dụ về “alkylaminocarbonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{NC(O)}-$  và  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NC(O)}-$ . Ví dụ về “dialkylaminocarbonyl” bao gồm  $(\text{CH}_3)_2\text{NC(O)}-$ . Ví dụ về “dialkylaminosulfonyl” bao gồm  $(\text{CH}_3)_2\text{NS(O)}_2-$ .

“Xycloalkyl” bao gồm, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl. Thuật ngữ “alkylxycloalkyl” dùng để chỉ sự thay thế alkyl trên xycloalkyl gốc và bao gồm, ví dụ, etylxyclopropyl, *i*-propylxyclobutyl, 3-metyl xyclopentyl và 4-metyl xyclohexyl. Thuật ngữ “xycloalkylalkyl” dùng để chỉ sự thay thế xycloalkyl trên gốc alkyl. Ví dụ về “xycloalkylalkyl” bao gồm xyclopropylmetyl, xyclopentyletyl, và khác xycloalkyl các gốc gắn kết với nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh. Thuật ngữ “xycloalkoxy” dùng để chỉ xycloalkyl được gắn qua nguyên tử oxy như xyclopentyloxy và xyclohexyloxy. “Xycloalkylalkoxycarbonyl” là để chỉ việc thế xycloalkyl trên nhóm alkoxycarbonyl. Ví dụ về “xycloalkylalkoxycarbonyl” bao gồm *c*-PrCH<sub>2</sub>OC(=O)-, *c*-BuCH<sub>2</sub>OC(=O)- và *c*-HexCH<sub>2</sub>OC(=O)-. “Xycloalkoxycarbonyl” là để chỉ việc thế xycloalkoxy trên nhóm carbonyl. Ví dụ về “xycloalkoxycarbonyl” bao gồm xyclopropoxycarbonyl, xyclopentoxycarbonyl, và các nhóm khác được liên kết với các nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh. “Xycloalkylalkoxy” dùng để chỉ xycloalkylalkyl được gắn qua nguyên tử oxy được gắn vào mạch alkyl. Ví dụ về “xycloalkylalkoxy” bao gồm xyclopropylmetoxy, xyclopentyletoxy, và các gốc xycloalkyl gắn kết với nhóm alkoxymạch thẳng hoặc mạch nhánh.

Thuật ngữ “halogen”, khi được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Ngoài ra, khi được sử dụng trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” thì alkyl này có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng nguyên tử halogen có thể là giống nhau hoặc khác nhau. Ví dụ về “haloalkyl” hoặc “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm  $\text{F}_3\text{C}-$ ,  $\text{ClCH}_2-$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2-$  và  $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ . Các thuật ngữ “haloxycloalkyl”, “haloalkoxy”, “haloalkoxyalkyl”, “haloalkylthio”, “haloalkylsulfinyl”, “haloalkylsulfonyl”, “haloalkylsulfonyloxy”, “haloalkenyl”, “haloalkenylalkyl”, “haloalkynyl”, “haloalkenyloxy”, “haloalkoxycarbonyl”, “haloalkylcarbonyloxy” và các nhóm tương tự khác, được xác định tương tự với thuật ngữ “haloalkyl”. Ví dụ về “haloalkoxy” bao gồm  $\text{CF}_3\text{O}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  và  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ . Ví dụ về “haloalkoxyalkyl” bao gồm  $\text{CCl}_3\text{OCH}_2-$ ,  $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$  và  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ . Ví dụ về “haloalkylthio” bao gồm  $\text{CCl}_3\text{S}-$ ,  $\text{CF}_3\text{S}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$  và  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ . Ví dụ về “haloalkylsulfinyl” bao gồm  $\text{CF}_3\text{S(O)}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{S(O)}-$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}-$  và  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}-$ . Ví dụ về “haloalkylsulfonyl” bao gồm  $\text{CF}_3\text{S(O)}_2-$ ,  $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2-$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$  và  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2-$ . Ví dụ về “haloalkylsulfonyloxy” bao gồm  $\text{CF}_3\text{S(O)}_2\text{O}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2\text{O}-$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2\text{O}-$  và

$\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ . Ví dụ về “haloalkenyl” và “haloalkenylalkyl” bao gồm  $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$  và  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ . Ví dụ về “haloalkynyl” bao gồm  $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$ ,  $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$  và  $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$ . Ví dụ về “haloalkoxyalkoxy” bao gồm  $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$  cũng như các dẫn xuất alkyl phân nhánh. Ví dụ về “haloalkenyloxy” bao gồm  $\text{CF}_3\text{CH}=\text{CHO}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CCl}=\text{ClCH}_2\text{O}-$  cũng như các dẫn xuất phân nhánh. Ví dụ về “haloalkoxycarbonyl” bao gồm  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$  và  $\text{CH}_3\text{CCl}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ . Ví dụ về “haloalkylcarbonyloxy” bao gồm  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ,  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$  và  $\text{CH}_3\text{CCl}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ .

“Alkylcarbonyl” là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc phân nhánh được liên kết với nhóm  $\text{C}(=\text{O})$ . Ví dụ về “alkylcarbonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$  và  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ . Ví dụ về “alkylcarbonylalkyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$  và  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{CH}_2-$ . Ví dụ về “alkoxycarbonyl” bao gồm  $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ ,  $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$  và các chất đồng phân butoxy- hoặc pentoxycarbonyl khác. “Alkylcarbonyloxy” là nhóm alkylcarbonyl được liên kết qua nguyên tử oxy được gắn vào carbonyl. Ví dụ về “alkylcarbonyloxy” bao gồm  $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$  và  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}-$ . “Alkylcarbonylamino” là nhóm alkylcarbonyl được liên kết qua nguyên tử của nhóm amino được gắn vào carbonyl. Ví dụ về “alkylcarbonylamino” bao gồm  $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$  và  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{NH}-$ . “Xycloalkylaminocarbonyl” là chỉ việc thế xycloalkyl trên nhóm aminocarbonyl. Ví dụ về “xycloalkylaminocarbonyl” bao gồm *c*-PrNHC(=O)-, *c*-BuNHC(=O)- và *c*-HexNHC(=O)-. “Xycloalkylcarbonyl” là chỉ việc thế xycloalkyl trên nhóm carbonyl. Ví dụ về “xycloalkylcarbonyl” bao gồm *c*-PrC(=O)-, *c*-BuCH<sub>2</sub>NHC(=O)- và *c*-HexCH<sub>2</sub>NHC(=O)-xycloalkylcarbonyl. “Xycloalkylcarbonylalkyl” là chỉ việc thế xycloalkyl trên nhóm carbonylalkyl. Ví dụ về “xycloalkylcarbonylalkyl” bao gồm *c*-PrC(=O)CH<sub>2</sub>-, *c*-Bu(=O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- và *c*-HexC(=O)CH<sub>2</sub>-.

Tổng số nguyên tử cacbon trong phần tử thế được biểu thị bằng tiền tố “Ci-Cj”, trong đó i và j là các số từ 1 đến 12. Ví dụ, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylsulfonyl bao gồm metylsulfonyl đến butyl. Ví dụ, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkyl bao gồm metyl đến butyl; C<sub>2</sub> alkoxyalkyl bao gồm CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>-; C<sub>3</sub> alkoxyalkyl bao gồm, ví dụ, CH<sub>3</sub>CH(OCH<sub>3</sub>)-, CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>- hoặc CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-; và C<sub>4</sub> alkoxyalkyl bao gồm các chất đồng phân khác nhau của nhóm alkyl được thế bằng nhóm alkoxy chứa tổng bốn nguyên tử cacbon, ví dụ, bao gồm CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>- và CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

Khi hợp chất được thế bằng phần tử thế mang chỉ số dưới biểu thị số phần tử thế có thể vượt quá 1, phần tử thế này (khi chúng vượt quá 1) độc lập được chọn từ nhóm các phần tử thế đã xác định, ví dụ,  $[(\text{R}^{10})_n]$ , n bằng 1, 2, 3, 4 hoặc 5. Ngoài ra, khi chỉ số dưới biểu thị một khoảng, ví dụ  $(\text{R})_{i-j}$ , thì số phần tử thế có thể được chọn từ các số nguyên nằm trong khoảng và bao gồm cả i và j. Khi nhóm chứa phần tử thế có thể là hydro, ví dụ, R<sup>1</sup> hoặc R<sup>6</sup>, thì khi phần tử thế này được lấy dưới dạng hydro, cần phải hiểu rằng phần tử này là tương đương với nhóm không được thế. Khi nhóm biến thiên thể hiện được gắn tùy ý với một vị trí, ví dụ,  $[(\text{R}^{10})_n]$ , trong đó có thể bằng 0, thì

hydro có thể ở vị trí thậm chí không được đề cập trong xác định của nhóm biến thiên. Khi một hoặc nhiều vị trí trên nhóm là “không thể” hoặc “không được thể”, thì có nghĩa là nguyên tử hydro được gắn để mang hóa trị tự do bất kỳ.

Cụm từ “bảo hoà hoàn toàn” liên quan đến vòng chứa nguyên tử có nghĩa là các gắn kết giữa nguyên tử của vòng này đều là liên kết đơn. Cụm từ “chưa bảo hoà hoàn toàn” liên quan đến vòng có nghĩa là các gắn kết giữa nguyên tử trong vòng là liên kết đơn hoặc liên kết đôi theo thuyết gắn kết hóa trị và hơn nữa các gắn kết giữa nguyên tử trong vòng bao gồm nhiều liên kết đôi nhất có thể mà không có các liên kết đôi bị chồng chất (tức là không có  $C=C=C$ ,  $N=C=C$ , v.v.). Thuật ngữ “chưa bảo hoà hoàn toàn” liên quan đến vòng biểu thị vòng chứa ít nhất một thành phần vòng gắn kết với thành phần vòng liền kề thông qua liên kết đôi và điều chỉnh tiềm năng về mặt khái niệm số liên kết đôi không chồng chất thông qua các thành phần vòng liền kề (tức là ở dạng tương ứng chưa bảo hoà hoàn toàn của nó) lớn hơn số liên kết đôi có mặt (tức là ở dạng chưa bảo hoà một phần của nó). Khi vòng chưa bảo hoà hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel thì nó có thể cũng được mô tả là vòng thơm.

Trừ khi có quy định khác, “vòng” hoặc “hệ vòng” dưới dạng thành phần có công thức 1 (ví dụ, phần tử thế  $Q^1$ ) là vòng cacbon hoặc dị vòng. Thuật ngữ “hệ vòng” dùng để chỉ hai hoặc nhiều vòng ngưng tụ. Các thuật ngữ “hệ vòng hai vòng” và “hệ vòng hai vòng ngưng tụ” dùng để chỉ hệ vòng bao gồm hai vòng ngưng tụ, trong đó vòng có thể là bão hoà, chưa bão hoà hoàn toàn, hoặc chưa bão hoà hoàn toàn trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “hệ vòng dị hai vòng ngưng tụ” dùng để chỉ hệ vòng hai vòng ngưng tụ, trong đó ít nhất một nguyên tử vòng không phải là cacbon. “Hệ vòng hai vòng được liên kết cầu nối” được tạo ra bằng cách gắn kết một phần của một hoặc nhiều nguyên tử với các thành phần vòng không liền kề của vòng. Thuật ngữ “thành phần vòng” dùng để chỉ nguyên tử hoặc gốc khác, ví dụ,  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(O)$  hoặc  $S(O)_2$  tạo ra khung của vòng hoặc hệ vòng.

Các thuật ngữ “nhân vòng cacbon”, “vòng cacbon” hoặc “hệ vòng vòng cacbon” dùng để chỉ vòng hoặc hệ vòng, trong đó nguyên tử tạo ra khung của vòng chỉ được chọn từ cacbon. Trừ khi có quy định khác, nhân vòng cacbon có thể là bão hoà, chưa bão hoà hoàn toàn, hoặc vòng chưa bão hoà hoàn toàn. Khi nhân vòng cacbon chưa bão hoà hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này cũng được gọi là “nhân thơm”. “Vòng cacbon bão hoà” dùng để chỉ vòng có khung bao gồm nguyên tử cacbon được liên kết với một nguyên tử khác bằng các liên kết đơn; trừ khi có quy định cụ thể khác, hóa trị cacbon còn lại được chiếm bởi nguyên tử hydro.

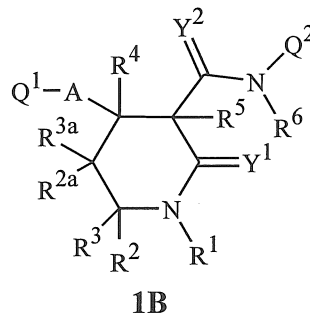
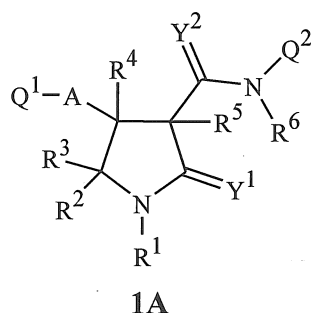
Các thuật ngữ “nhân dị vòng”, “dị vòng” hoặc “hệ vòng dị vòng” dùng để chỉ vòng hoặc hệ vòng, trong đó ít nhất một nguyên tử tạo ra khung của vòng không phải là cacbon, ví dụ, nitơ, oxy hoặc lưu huỳnh. Thông thường, nhân dị vòng chứa không quá 4 nguyên tử nitơ, không quá 2 nguyên tử oxy và không quá 2 nguyên tử lưu huỳnh. Trừ khi có quy định khác, nhân dị vòng có thể là bão hoà, chưa bão hoà hoàn toàn, hoặc vòng chưa bão hoà hoàn toàn. Khi nhân dị vòng chưa bão hoà hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này cũng được gọi là “vòng dị thơm” hoặc “vòng dị thơm”. Thuật ngữ “hệ vòng hai vòng dị vòng thơm” là để chỉ hệ vòng hai vòng, trong

đó ít nhất một trong số hệ vòng này là thơm. Trừ khi có quy định khác, các vòng và hệ vòng dị vòng có thể được gắn thông qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ bất kỳ bằng cách thay thế hydro trên nguyên tử cacbon hoặc nitơ này.

Thuật ngữ “thơm” chỉ ra rằng mỗi nguyên tử vòng về cơ bản trong cùng một mặt phẳng và có quỹ đạo  $p$  vuông góc với mặt phẳng của vòng, và các điện tử  $(4n + 2) \pi$ , trong đó  $n$  là số nguyên dương, đi liền với vòng phù hợp với quy tắc Hückel. Thuật ngữ “hệ vòng thơm” dùng để chỉ vòng cacbon hoặc hệ vòng dị vòng, trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng là thơm.

Thuật ngữ “tùy ý được thế” liên quan đến các nhân dị vòng dùng để chỉ các nhóm không được thế hoặc có ít nhất một phần tử thế không phải là hydro không triệt tiêu hoạt tính sinh học đã có của chất tương tự không được thế. Như được sử dụng trong bản mô tả này, định nghĩa sau sẽ áp dụng trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “tùy ý được thế” được sử dụng hoán đổi với cụm từ “được thế hoặc không được thế” hoặc với thuật ngữ “(không) được thế.” Trừ khi có quy định khác, nhóm tùy ý được thế có thể có phần tử thế ở mỗi vị trí thế của nhóm, và mỗi sự thay thế đều độc lập với nhau.

Như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế J có thể là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-$ ; hoặc  $-\text{CR}^2\text{R}^3-\text{CR}^{2a}\text{R}^{3a}-$ , trong đó nhóm  $-\text{CR}^2\text{R}^3-$  được liên kết trực tiếp với N. Ví dụ, khi J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-$ , hợp chất có công thức 1 được biểu thị bằng công thức 1A. Khi J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-\text{CR}^{2a}\text{R}^{3a}-$ , hợp chất có công thức 1 được biểu thị bằng công thức 1B:



trong đó mỗi nhóm trong số các biến số còn lại là được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế.

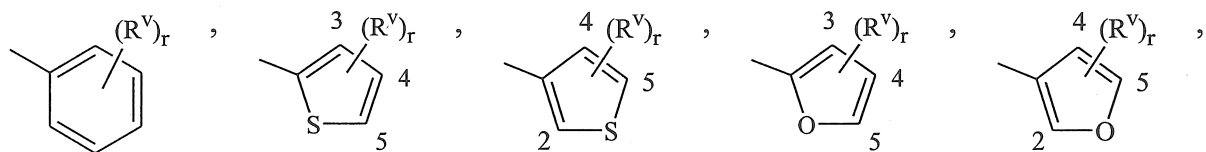
Như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, A có thể là mạch bão hòa, chưa bão hòa một phần hoặc chưa bão hòa hoàn toàn chứa 1 đến 3 nguyên tử được chọn từ tối đa 3 nguyên tử cacbon, tối đa 1 nguyên tử O, tối đa 1 nguyên tử S và tối đa 2 nguyên tử N, trong đó tối đa 2 thành phần cacbon độc lập được chọn từ  $\text{C}(=\text{O})$  và  $\text{C}(=\text{S})$  và thành phần nguyên tử lưu huỳnh được chọn từ  $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^8)_v$ ; mạch nói trên tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{15}$  trên nguyên tử cacbon và  $\text{R}^{16}$  trên nguyên tử nitơ. Ví dụ về A bao gồm  $-\text{ON}=\text{CH}-$ ,  $-\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{NHN}=\text{CH}-$ ,  $-\text{NHN}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{N}=\text{CH}-$ ,  $-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}=\text{NO}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NO}-$ ,  $-\text{CH}=\text{NNH}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NNH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{N}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CF}_2-$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{C}\square\text{CCH}_2-$ ,

$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$ ,  $-\text{SO}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{NH}-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$  và  $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2-$ , trong đó liên kết hướng về phía trái được liên kết với nhóm  $\text{Q}^1$ , và liên kết hướng về phía phải được liên kết với phần còn lại của công thức 1.

Như nêu trên,  $\text{Q}^1$  và  $\text{Q}^2$  có thể là (ngoài những nhóm khác) phenyl tùy ý được thể bằng một hoặc nhiều phần tử thể được chọn từ nhóm phần tử thể như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Một ví dụ về phenyl tùy ý được thể bằng 1 đến 5 phần tử thể là vòng được minh họa dưới dạng U-1 trong Bảng thể hiện 1, trong đó, ví dụ,  $\text{R}^v$  là  $\text{R}^7$  như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế cho  $\text{Q}^1$ , và  $r$  là số nguyên (từ 0 đến 5); hoặc  $\text{R}^v$  là  $\text{R}^{10}$  như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế cho  $\text{Q}^2$ , và  $r$  là một số nguyên (từ 0 đến 5); hoặc  $\text{R}^v$  là  $\text{R}^9$  như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với  $\text{Q}^1$  và  $r$  là số nguyên (từ 0 đến 5) khi  $\text{R}^v$  được liên kết với nguyên tử nitơ; hoặc  $\text{R}^v$  là  $\text{R}^{11}$  như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với  $\text{Q}^2$  và  $r$  là số nguyên (từ 0 đến 5) khi  $\text{R}^v$  được liên kết với nguyên tử nitơ. Trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế  $\text{R}^1$  có thể là arylcarbonyl, arylalkenylalkyl, arylcarbonylalkyl hoặc  $-\text{CPh}=\text{N}-\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_4 \text{ alkyl})$ , mỗi nhóm này tùy ý được thể trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thể độc lập được chọn từ  $\text{R}^{13}$ . Trong bản mô tả này, thuật ngữ “aryl” có thể được thể bằng  $\text{R}^{13}$  và được liên kết với phần còn lại của công thức 1 qua nhóm carbonyl, nhóm alkenylalkyl hoặc nhóm carbonylalkyl như được xác định trên đây (ví dụ, aryl( $\text{C}=\text{O}$ )-, aryl( $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkenylalkyl)- hoặc aryl( $\text{C}=\text{O}$ )( $\text{C}_1-\text{C}_4$  alkyl)-). Nhóm phenyl trong nhóm  $-\text{CPh}=\text{N}-\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_4 \text{ alkyl})$  có thể được thể tiếp bằng  $\text{R}^{13}$ .

Như nêu trên,  $\text{Q}^1$  và  $\text{Q}^2$  có thể là (ngoài những nhóm khác) vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, tùy ý được thể bằng một hoặc nhiều phần tử thể được chọn từ nhóm phần tử thể như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thể bằng từ một hoặc nhiều phần tử thể bao gồm các vòng U-2 đến U-61 được minh họa trong Bảng thể hiện 1, trong đó  $\text{R}^v$  là phần tử thể bất kỳ như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế cho  $\text{Q}^1$  và  $\text{Q}^2$ , và  $r$  là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4, giới hạn bởi số các vị trí sẵn có trên mỗi nhóm U. Đối với U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 và U-43 chỉ có một vị trí sẵn có, đối với các nhóm U này  $r$  được giới hạn ở các số nguyên 0 hoặc 1, và  $r$  là 0 có nghĩa là nhóm U là không được thể và hydro có mặt ở vị trí được chỉ ra bởi  $(\text{R}^v)_r$ .

Bảng thể hiện 1



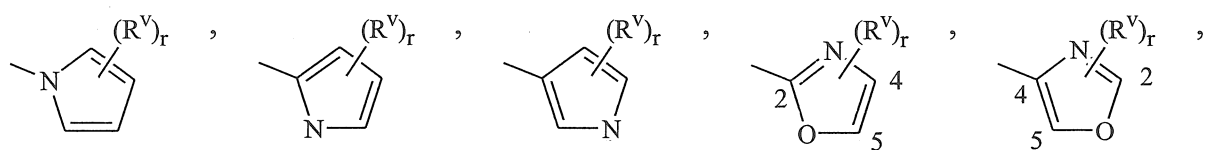
U-1

U-2

U-3

U-4

U-5



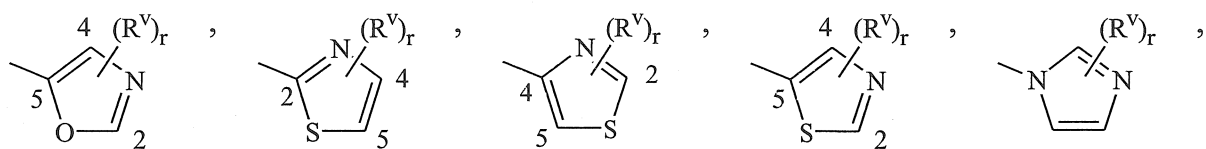
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



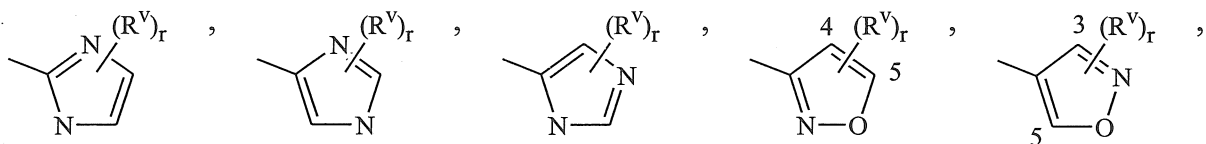
U-11

U-12

U-13

U-14

U-15



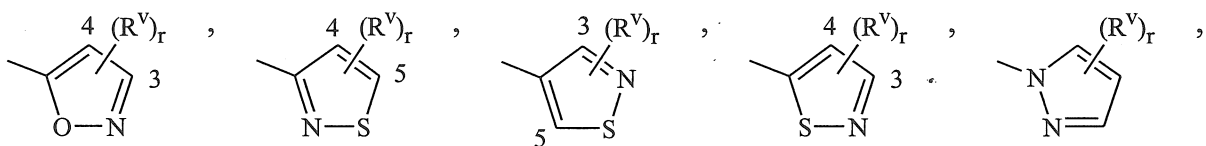
U-16

U-17

U-18

U-19

U-20



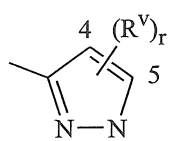
U-21

U-22

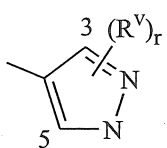
U-23

U-24

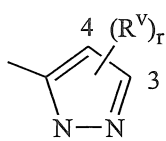
U-25



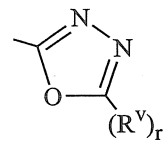
U-26



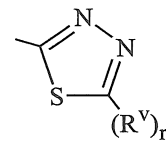
U-27



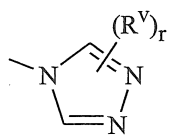
U-28



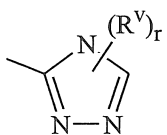
U-29



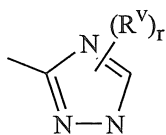
U-30



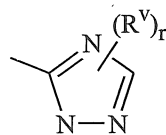
U-31



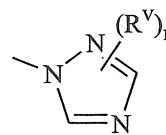
U-32



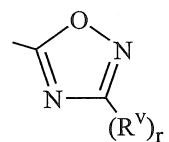
U-33



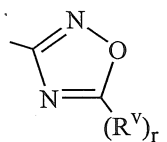
U-34



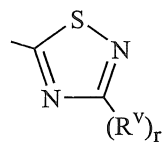
U-35



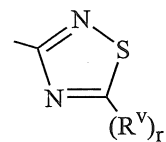
U-36



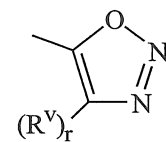
U-37



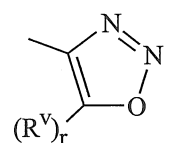
U-38



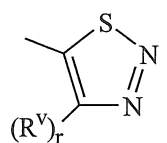
U-39



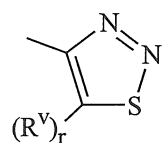
U-40



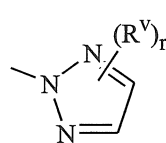
U-41



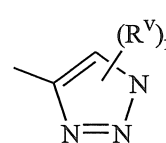
U-42



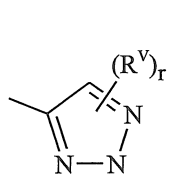
U-43



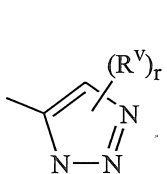
U-44



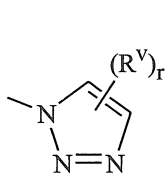
U-45



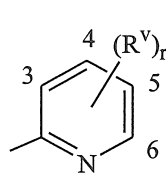
U-46



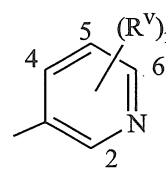
U-47



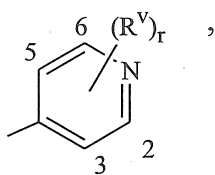
U-48



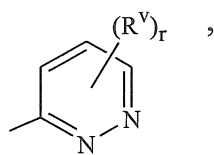
U-49



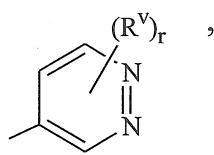
U-50



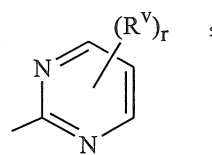
U-51



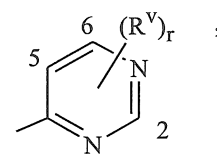
U-52



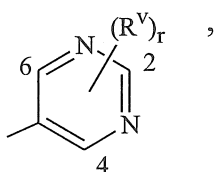
U-53



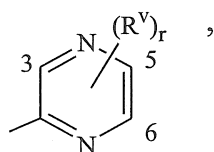
U-54



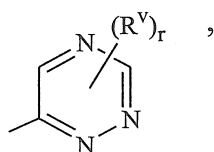
U-55



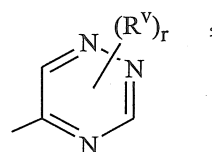
U-56



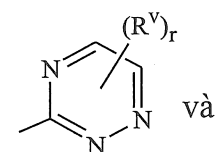
U-57



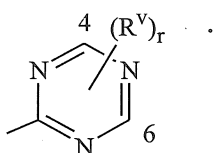
U-58



U-59



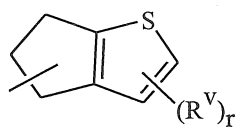
U-60



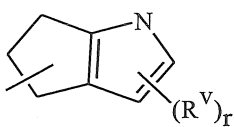
U-61

Như nêu trên,  $Q^1$  và  $Q^2$  có thể là (trong số những cái khác) hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh tùy ý được thể bằng một hoặc nhiều phần tử thể được chọn từ nhóm phần tử thể như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế (tức là  $R^7$  và  $R^{10}$ ). Ví dụ về hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh tùy ý được thể bằng từ một hoặc nhiều phần tử thể bao gồm các vòng U-62 đến U-100 được minh họa trong Bảng thể hiện 2, trong đó  $R^v$  là phần tử thể bất kỳ như được xác định trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế cho  $Q^1$  hoặc  $Q^2$ , và  $r$  thường là số nguyên từ 0 đến 5.

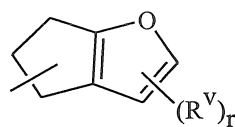
Bảng thể hiện 2



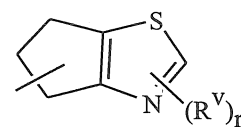
U-62



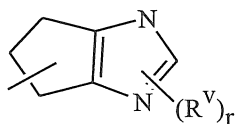
U-63



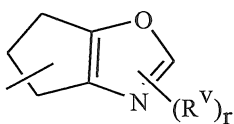
U-64



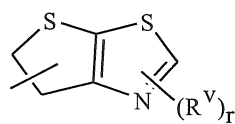
U-65



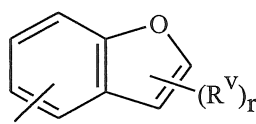
U-66



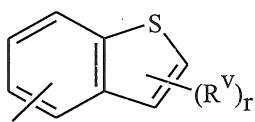
U-67



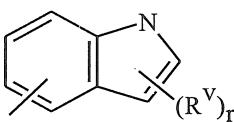
U-68



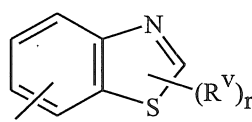
U-69



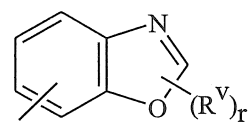
U-70



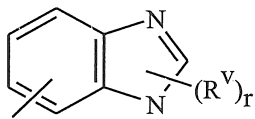
U-71



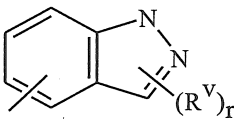
U-72



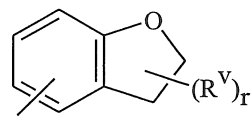
U-73



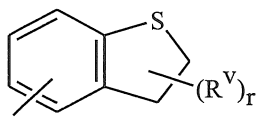
U-74



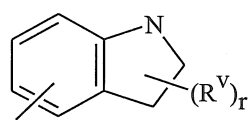
U-75



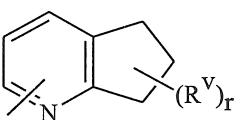
U-76



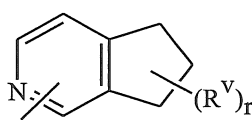
U-77



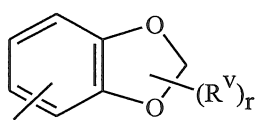
U-78



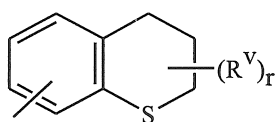
U-79



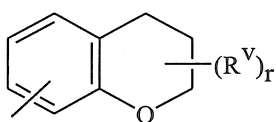
U-80



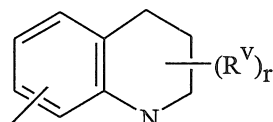
U-81



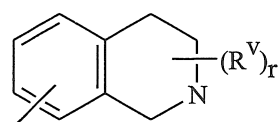
U-82



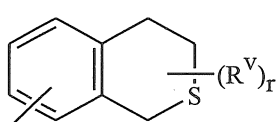
U-83



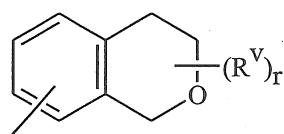
U-84



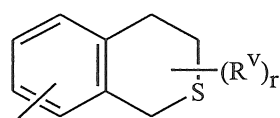
U-85



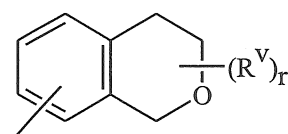
U-86



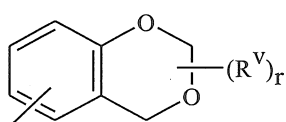
U-87



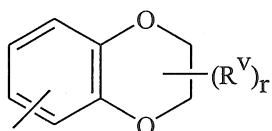
U-88



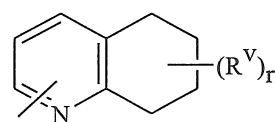
U-89



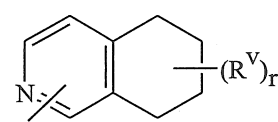
U-90



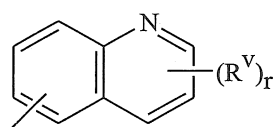
U-91



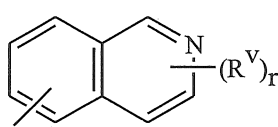
U-92



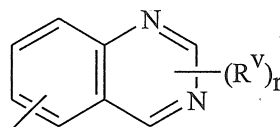
U-93



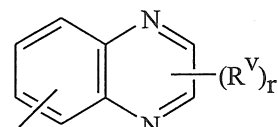
U-94



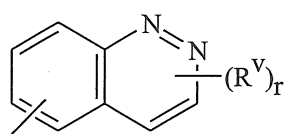
U-95



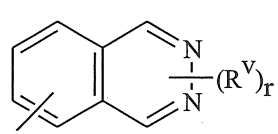
U-96



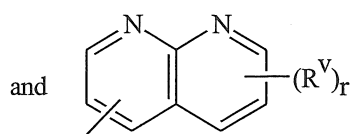
U-97



U-98



U-99



U-100

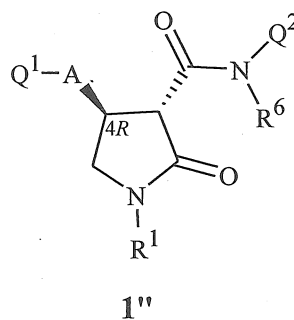
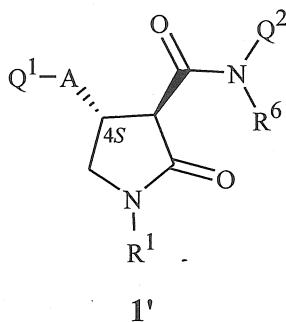
Mặc dù các nhóm  $R^V$  được chỉ ra trong các cấu trúc U-1 đến U-100, lưu ý rằng chúng không cần có mặt do chúng là phần tử thế tùy ý. Lưu ý rằng khi  $R^V$  là H khi được gắn vào nguyên tử, thì nó là giống nhau như thể nguyên tử này không được thế. Nguyên tử nitơ cần thay thế để đáp ứng hóa trị của chúng được thế bằng H hoặc  $R^V$ . Lưu ý rằng khi điểm gắn kết giữa  $(R^V)_r$  và nhóm U được minh họa dưới dạng treo lơ lửng,  $(R^V)_r$  có thể được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nitơ sẵn có bất kỳ của nhóm U. Lưu ý rằng khi điểm gắn kết trên nhóm U được minh họa dưới dạng treo lơ lửng, nhóm U có thể được gắn vào phần còn lại của công thức 1 thông qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ sẵn có bất kỳ của nhóm U bằng cách thay thế nguyên tử hydro. Lưu ý rằng một số nhóm U chỉ có thể được thế bằng nhỏ hơn 4 nhóm  $R^V$  (ví dụ, U-2 đến U-5, U-7 đến U-48, và U-52 đến U-61).

Nhiều phương pháp tổng hợp khác nhau đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này để có thể điều chế các vòng và hệ vòng dị thơm và không thơm; để xem xét kỹ hơn tham

khảo bộ tám tập *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky và C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 và bộ mười hai tập *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees và E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân lập thể. Chất đồng phân lập thể khác nhau bao gồm các chất đồng phân đối ảnh, các chất đồng phân không đối quang, các chất đồng phân atropy và các chất đồng phân dị hình. Chất đồng phân lập thể là các chất đồng phân có cấu trúc giống nhau nhưng khác nhau về việc sắp xếp nguyên tử của chúng trong không gian và bao gồm chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân cis-trans (còn gọi là chất đồng phân dị hình) và chất đồng phân atropy. Chất đồng phân atropy là kết quả của việc quay có hạn chế quanh các liên kết đơn mà tại đó hàng rào quay là đủ lớn để cho phép tách các chất đồng phân. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng một chất đồng phân lập thể có thể hoạt động nhiều hơn và/hoặc có thể có các tác dụng có lợi khi được làm giàu tương đối so với các chất đồng phân lập thể khác hoặc khi được tách khỏi các chất đồng phân lập thể khác. Ngoài ra, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng biết cách để tách, làm giàu, và/hoặc điều chế một cách có chọn lọc các chất đồng phân lập thể này. Hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng hỗn hợp chứa chất đồng phân lập thể, chất đồng phân lập thể riêng rẽ hoặc dưới dạng quang hoạt. Cụ thể là khi mỗi  $R^4$  và  $R^5$  là H, phần tử thế  $C(O)N(Q^2)(R^6)$  và  $Q^1$  phần lớn là ở dạng cấu hình trans được ưu tiên về mặt nhiệt động trên nhân amit vòng.

Ví dụ, nhóm  $C(O)N(Q^2)(R^6)$  (tức là mỗi  $Y^1$  và  $Y^2$  là O; và J là  $-CR^2R^3-$ ; và  $R^2$  là H; và  $R^3$  là H) gắn kết với nguyên tử cacbon ở vị trí thứ 3 của vòng amit vòng và  $-A-Q^1$  (gắn kết với nguyên tử cacbon ở vị trí thứ 4 của vòng amit vòng) thường được tìm thấy trong cấu hình *trans*. Các nguyên tử cacbon ở cả hai vị trí 3 và 4 này đều có tâm không đối xứng. Cặp các chất đồng phân đối ảnh phổ biến nhất được biểu thị dưới dạng Công thức 1' và Công thức 1''. Mặc dù sáng chế đề cập đến tất cả các chất đồng phân lập thể, chất đồng phân đối ảnh được ưu tiên về khả năng kiểm soát sinh học được xác định dưới dạng Công thức 1'. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ hiểu rõ về việc chỉ định *R* hoặc *S* ở tâm không đối xứng cụ thể là chức năng của mẫu thể đặc hiệu ở tâm này. Do đó, đối với các hợp chất có công thức 1' và 1'', chúng có thể được giữ nguyên tùy thuộc vào giá trị biến số A. Để xem xét toàn diện về tất cả các khía cạnh của chất đồng phân lập thể, xem Ernest L. Eliel và Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Hợp chất*, John Wiley & Sons, 1994.



Phần mô tả phân tử được thể hiện bằng hình vẽ trong bản mô tả này tuân theo quy ước chuẩn về mô tả hóa học lập thể. Để thể hiện cấu hình lập thể, các liên kết xuất hiện trên mặt phẳng của hình vẽ và hướng đến người xem được thể hiện bằng các đường gạch chéo, trong đó điểm cuối rộng của đường nối này được gắn vào nguyên tử xuất hiện trên mặt phẳng của hình vẽ về phía người xem. Các gắn kết bên dưới mặt phẳng của hình vẽ và cách xa người xem được biểu hiện bằng các đường nối phụ, trong đó điểm cuối hẹp của đường nối này được gắn vào nguyên tử cách xa hơn nữa người xem. Đường kẻ rộng cố định để chỉ gắn kết có hướng ngược lại hoặc trung tính so với gắn kết được thể hiện bằng các đường gạch chéo hoặc đường nối phụ; đường kẻ rộng cố định cũng thể hiện gắn kết trong các phân tử hoặc các phần của phân tử mà cấu hình lập thể đặc biệt không được dự định để mô tả cụ thể.

Sáng chế cũng bao gồm các hỗn hợp raxemic, ví dụ, lượng bằng nhau của các chất đồng phân đối ảnh có các công thức 1' và 1''. Ngoài ra, sáng chế bao gồm hợp chất được làm giàu so với hỗn hợp raxemic trong chất đồng phân đối ảnh có công thức 1. Sáng chế cũng bao gồm các chất đồng phân đối ảnh hầu như tinh khiết của hợp chất có công thức 1, ví dụ, Công thức 1' và Công thức 1''.

Khi được làm giàu về mức đồng phân đối ảnh, một chất đồng phân đối ảnh có mặt với lượng lớn hơn so với các chất đồng phân đối ảnh khác, và mức độ giàu này có thể được xác định bằng sự biểu thị của lượng dư đồng phân đối ảnh (*enantiomeric excess*: “ee”), lượng này được xác định là  $(2x-1) \cdot 100\%$ , trong đó x là tỷ lệ mol của chất đồng phân đối ảnh nổi trội trong hỗn hợp (ví dụ, ee là 20% tương ứng với tỷ lệ 60:40 của các chất đồng phân đối ảnh).

Tốt hơn là, chế phẩm theo sáng chế có ít nhất 50% lượng dư đồng phân đối ảnh; tốt hơn nữa là ít nhất 75% lượng dư đồng phân đối ảnh; còn tốt hơn nữa là ít nhất 90% lượng dư đồng phân đối ảnh; và tốt nhất là ít nhất 94% lượng dư đồng phân đối ảnh của chất đồng phân hoạt động hơn. Được ưu tiên là các phương án độ tinh khiết về mặt đồng phân đối ảnh của chất đồng phân hoạt động hơn.

Hợp chất có công thức 1 có thể chứa các tâm không đối xứng bổ sung. Ví dụ, chính các phân tử thể và các hợp phân phân tử khác như R<sup>7</sup> và R<sup>10</sup> có thể chứa các tâm không đối xứng. Sáng chế bao hàm hỗn hợp raxemic cũng như các cấu hình lập thể giàu và gần như tinh khiết ở các tâm không đối xứng bổ sung này.

Hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân cấu hình do sự quay giới hạn ở khoảng gắn kết amit (ví dụ  $C(O)N(Q^2)(R^6)$  khi  $Y^1$  là O) trong Công thức 1. Sáng chế bao gồm hỗn hợp của chất đồng phân cấu hình. Ngoài ra, sáng chế bao gồm hợp chất được làm giàu ở conforme so với các hợp chất khác.

Hợp chất có công thức 1 thường tồn tại ở nhiều hơn một dạng, và do đó Công thức 1 bao gồm tất cả các dạng tinh thể và không tinh thể của các hợp chất chúng có mặt. Dạng không tinh thể bao gồm các phương án là chất rắn như sáp và gồm cũng như các phương án là chất lỏng như dung dịch và chất nóng chảy. Dạng tinh thể bao gồm các phương án về cơ bản là dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp chứa chất đa hình (tức là các dạng tinh thể khác nhau). Thuật ngữ “dạng đa hình” được dùng để chỉ dạng tinh thể cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng tinh thể khác nhau, các dạng này có các phân tử trong mạng tinh thể có sự sắp xếp và/hoặc cấu hình khác nhau. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hóa học giống nhau, chúng cũng có thể khác nhau về thành phần do sự có mặt hoặc không có mặt của nước đồng kết tinh hoặc các phân tử khác, có thể được liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng này. Chất đa hình có thể khác về các đặc tính hóa học, vật lý và sinh học như hình dạng, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ ổn định hóa học, điểm nóng chảy, độ ẩm, độ nhạy, tốc độ hòa tan và tính sinh khả dụng của tinh thể. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng chất đa hình của hợp chất có công thức 1 có thể có các tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế các chế phẩm hữu ích, đặc tính sinh học cải thiện) so với các chất đa hình khác hoặc hỗn hợp của chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách chất đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 có thể đạt được bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này bao gồm, ví dụ, phương pháp kết tinh bằng cách sử dụng các dung môi và các nhiệt độ đã chọn. Để xem xét toàn diện về chất đa hình, xem R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industrial*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng không phải tất cả các dị vòng chứa nitơ có thể tạo thành các *N*-oxit vì nitơ cần một cặp đơn lẻ để oxy hoá thành oxit; người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng các dị vòng chứa nitơ này có thể tạo thành các *N*-oxit. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực cũng cần hiểu rằng các amin bậc ba có thể tạo thành *N*-oxit. Các phương pháp tổng hợp để điều chế các *N*-oxit của các dị vòng và amin bậc ba là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này bao gồm phương pháp oxy hoá dị vòng và amin bậc ba bằng các axit peroxy như axit peraxetic và 3-cloperbenzoic (MCPBA), hydro peroxit, alkyl hydroperoxit như *t*-butyl hydroperoxit, natri perborat, và dioxiran như dimetyldioxiran. Các phương pháp điều chế các *N*-oxit này được mô tả rộng rãi và xem xét trong tài liệu, ví dụ: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler và B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton và A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett và B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161,

A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler và B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press; và G. W. H. Cheeseman và E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky và A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng do môi trường và các điều kiện sinh lý học, các muối của hợp chất hoá học ở trạng thái cân bằng với các dạng không muối tương ứng của chúng, các muối có tính hữu ích sinh học của các dạng không muối. Do đó, rất nhiều dạng muối của hợp chất có công thức 1 có thể dùng để diệt cỏ. Các muối của hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc hữu cơ như axit bromhydric, axit clohydric, axit nitric, axit phosphoric, axit lưu huỳnhic, axit axetic, axit butyric, axit fumaric, axit lactic, axit maleic, axit malonic, axit oxalic, axit propionic, axit salixylic, axit tartaric, axit 4-toluensulfonic hoặc axit valeric. Khi hợp chất có công thức 1 chứa gốc axit như axit carboxylic hoặc phenol, muối cũng bao gồm các muối được tạo ra từ các bazơ vô cơ hoặc hữu cơ như pyridin, trietylamin hoặc amoniac, hoặc amin, hydrit, hydroxit hoặc carbonat của natri, kali, lithi, canxi, magie hoặc bari. Do đó, sáng chế bao gồm hợp chất được chọn từ hợp chất có công thức 1, N-oxit và các muối thích hợp của chúng.

Các phương án theo sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm (trong đó Công thức 1 được sử dụng trong các phương án sau bao gồm N-oxit và các muối của chúng):

Phương án 1. Hợp chất có công thức 1, trong đó A là:

$-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{N}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{NCH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  
 $-\text{NH}-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$  hoặc  $-\text{SO}_2-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $\text{Q}^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1.

Phương án 2. Hợp chất theo Phương án 1, trong đó A là  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  
 $-\text{CH}_2\text{N}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{NCH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{N}-$   
 hoặc  $-\text{O}-$ .

Phương án 3. Hợp chất theo Phương án 2, trong đó A là  $-\text{CH}_2-$ .

Phương án 4. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 3, trong đó  $\text{Q}^1$  là vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $\text{R}^9$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng.

Phương án 5. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 3, trong đó  $\text{Q}^1$  là vòng phenyl

hoặc hệ vòng naphthalenyl, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ .

Phương án 6. Hợp chất theo Phương án 5, trong đó  $Q^1$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ .

Phương án 7. Hợp chất theo Phương án 6, trong đó  $Q^1$  là vòng phenyl được thế bằng 1 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ .

Phương án 8. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 7, trong đó khi  $Q^2$  là vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $R^{11}$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng.

Phương án 9. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 7, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ .

Phương án 10. Hợp chất theo Phương án 9, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ .

Phương án 11. Hợp chất theo Phương án 10, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ .

Phương án 12. Hợp chất theo Phương án 9, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl có ít nhất một phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  ở vị trí ortho (và tùy ý phần tử thế khác).

Phương án 13. Hợp chất theo Phương án 12, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl có 2 phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và một trong số các phần tử thế này là ở vị trí ortho và phần tử thế khác nêu trên là ở vị trí meta hoặc para.

Phương án 14. Hợp chất theo Phương án 10, trong đó khi  $Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng ba phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và ba phần tử thế là ở vị trí ortho (ví dụ, 2-), meta (ví dụ, 3-) và para (ví dụ, 4-) positions (của vòng phenyl).

Phương án 15. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 14, trong đó  $Y^1$  là O.

Phương án 16. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 15, trong đó  $Y^2$  là O.

Phương án 17. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 16, trong đó  $Y^1$  và  $Y^2$  đều là O.

Phương án 18. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 17, trong đó J là  $-CR^2R^3-$ .

Phương án 19. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 17, trong đó J là  $-CR^2R^3-CR^2aR^3a-$ .

Phương án 20. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 19, trong đó  $R^1$  là H, hydroxy,

amino, xyano, formyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonylalkyl, -C(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl)=N-O(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl), -C(O)NH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> xyanoalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl hoặc C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl.

Phương án 21. Hợp chất theo Phương án 20, trong đó R<sup>1</sup> là H, hydroxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> xyanoalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> xycloalkyl hoặc C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl.

Phương án 22. Hợp chất theo Phương án 21, trong đó R<sup>1</sup> là H, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl hoặc C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl.

Phương án 23. Hợp chất theo Phương án 22, trong đó R<sup>1</sup> là H, Me, Et hoặc CHF<sub>2</sub>.

Phương án 24. Hợp chất theo Phương án 23, trong đó R<sup>1</sup> là H, Me hoặc Et.

Phương án 25. Hợp chất theo Phương án 24, trong đó R<sup>1</sup> là H.

Phương án 26. Hợp chất theo Phương án 24, trong đó R<sup>1</sup> là Me.

Phương án 27. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 26, trong đó R<sup>2</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 28. Hợp chất theo Phương án 27, trong đó R<sup>2</sup> là H.

Phương án 29. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 28, trong đó R<sup>3</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 30. Hợp chất theo Phương án 29, trong đó R<sup>3</sup> là H.

Phương án 31. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 30, trong đó R<sup>2a</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 32. Hợp chất theo Phương án 31, trong đó R<sup>2a</sup> là H.

Phương án 33. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 32, trong đó R<sup>3a</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 34. Hợp chất theo Phương án 33, trong đó R<sup>3a</sup> là H.

Phương án 35. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 34, trong đó R<sup>4</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 36. Hợp chất theo Phương án 35, trong đó R<sup>4</sup> là H.

Phương án 37. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 36, trong đó R<sup>5</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 38. Hợp chất theo Phương án 37, trong đó R<sup>5</sup> là H.

Phương án 39. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 38, trong đó R<sup>6</sup> là H, hydroxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl hoặc C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl.

Phương án 40. Hợp chất theo Phương án 39, trong đó R<sup>6</sup> là H hoặc CH<sub>3</sub>.

Phương án 41. Hợp chất theo Phương án 40, trong đó R<sup>6</sup> là H.

Phương án 42. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 41, trong đó mỗi R<sup>7</sup> độc lập là

halogen, xyano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> alkylxycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> dialkylamino, formylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonylamino, -SF<sub>5</sub>, -SCN, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy.

Phương án 43. Hợp chất theo Phương án 42, trong đó mỗi R<sup>7</sup> độc lập là halogen, xyano, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalkyl hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alkylsulfonyl.

Phương án 44. Hợp chất theo Phương án 43, trong đó mỗi R<sup>7</sup> độc lập là halogen hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl.

Phương án 45. Hợp chất theo Phương án 44, trong đó mỗi R<sup>7</sup> độc lập là halogen hoặc CF<sub>3</sub>.

Phương án 46. Hợp chất theo Phương án 45, trong đó mỗi R<sup>7</sup> độc lập là F, Cl hoặc CF<sub>3</sub>.

Phương án 47. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến Phương án 46, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl.

Phương án 48. Hợp chất theo Phương án 47, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen, xyano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalkyl hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alkylsulfonyl.

Phương án 49. Hợp chất theo Phương án 48, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen hoặc C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalkyl.

Phương án 50. Hợp chất theo Phương án 49, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen hoặc CF<sub>3</sub>.

Phương án 51. Hợp chất theo Phương án 50, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là F hoặc CF<sub>3</sub>.

Phương án 52. Hợp chất theo Phương án 51, trong đó mỗi R<sup>10</sup> độc lập là F.

Phương án 53. Hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1, 2 hoặc 4 đến 52, trong đó A là -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(=O)NH-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -C(=O)NH-, -CH<sub>2</sub>NH-, -OCH<sub>2</sub>-, -NHCH<sub>2</sub>-, -CH=CH-, -C≡C-, -N-,

–O–, –S–, –SO– hoặc –SO<sub>2</sub>–, trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với Q<sup>1</sup> và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1.

Phương án 54. Hợp chất theo Phương án 54, trong đó A là –CH<sub>2</sub>–, –CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>–, –C(=O)NH–, –CH=CH– hoặc –C≡C–, trong đó liên kết hướng về phía trái được liên kết với nhóm Q<sup>1</sup>, và liên kết hướng về phía phải được liên kết với phần còn lại của công thức 1.

Phương án 55. Hợp chất theo Phương án 54 trong đó A là –CH<sub>2</sub>–, –CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>–, –CH=CH– hoặc –C≡C–.

Phương án 56. Hợp chất theo Phương án 55, trong đó A là –CH<sub>2</sub>–.

Phương án 57. Hợp chất theo Phương án 55, trong đó A là –CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>–.

Phương án 58. Hợp chất theo Phương án 56, trong đó A là –CH=CH–.

Phương án 59. Hợp chất theo Phương án 56, trong đó A là –C≡C–.

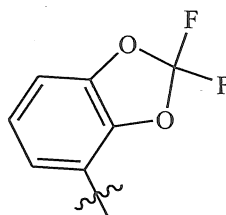
Phương án 60. Hợp chất theo Phương án 1, trong đó Q<sup>1</sup> là hệ vòng hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi hệ vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O và tối đa 2 nguyên tử N, trong đó tối đa 3 thành phần nguyên tử cacbon trong vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), mỗi hệ vòng tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ R<sup>9</sup> thành phần nguyên tử nitơ của vòng.

Phương án 61. Hợp chất theo Phương án 60, trong đó Q<sup>1</sup> là hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 9 cạnh, mỗi hệ vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, mỗi hệ vòng tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng.

Phương án 62. Hợp chất theo Phương án 61, trong đó Q<sup>1</sup> là hệ vòng hai vòng dị thơm có 9 cạnh chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, mỗi hệ vòng tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng.

Phương án 63. Hợp chất theo Phương án 62, trong đó Q<sup>1</sup> là hệ vòng hai vòng dị thơm có 9 cạnh chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và 2 nguyên tử O, hệ này tùy ý được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng (tức là U-81 trong Bảng thể hiện 2).

Phương án 64. Hợp chất theo Phương án 63, trong đó Q<sup>1</sup> là U-81A;



U-81A

Phương án 65. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến 3, 5 hoặc 8 đến 64, trong đó  $Q^1$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ ; hoặc vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $R^9$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng.

Phương án 66. Hợp chất có công thức 1 hoặc hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án 1 đến 7 hoặc 15 đến 65, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ ; hoặc vòng dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn có 5 đến 6 cạnh, mỗi vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{11}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $R^{11}$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng.

Phương án 67. Hợp chất theo Phương án 66, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ ; hoặc vòng dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn có 6 cạnh, mỗi vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 4 nguyên tử N, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{11}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng.

Phương án 68. Hợp chất theo Phương án 67, trong đó  $Q^2$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ ; hoặc vòng pyridyl, tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{11}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng.

Phương án 69. Hợp chất theo Phương án 68, trong đó  $Q^2$  là vòng 3-pyridyl tùy ý được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng.

- Phương án 70. Hợp chất theo Phương án 69, trong đó  $Q^2$  là vòng 3-pyridyl tùy ý được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $C_1$ - $C_8$  alkyl hoặc  $C_1$ - $C_8$  haloalkyl.
- Phương án 71. Hợp chất có công thức 1, trong đó A là  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-OCH_2-$ ,  $-NHCH_2-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  hoặc  $-SO_2-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $Q^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1.
- Phương án 72. Hợp chất theo công thức 2, trong đó A là, trong đó A là  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-OCH_2-$ ,  $-NHCH_2-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$  hoặc  $-O-$ .
- Phương án 73. Hợp chất có công thức 1, trong đó A được chọn từ  $-ON=CH-$ ,  $-ON=C(CH_3)-$ ,  $-NHN=CH-$ ,  $-NHN=C(CH_3)-$ ,  $-N=CH-$ ,  $-N=C(CH_3)-$ ,  $-CH=NO-$ ,  $-C(CH_3)=NO-$ ,  $-CH=NNH-$ ,  $-C(CH_3)=NNH-$ ,  $-CH=N-$ ,  $-C(CH_3)=N-$ ,  $-CH_2CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2-$ ,  $-CF_2-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-CH=CHCH_2-$ ,  $-CH_2CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-C\equiv CCH_2-$ ,  $-CH_2C\equiv C-$ ,  $-CH_2CH_2O-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-O-$ ,  $-OCH_2CH_2-$ ,  $-OCH_2-$ ,  $-CH_2CH_2S-$ ,  $-CH_2S-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-SCH_2CH_2-$ ,  $-SCH_2-$ ,  $-CH_2CH_2NH-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-NH-$ ,  $-NHCH_2-$  và  $-NHCH_2CH_2-$ , trong đó liên kết hướng về phía trái được liên kết với nhóm  $Q^1$ , và liên kết hướng về phía phải được liên kết với phần còn lại của công thức 1.
- Phương án 74. Hợp chất theo Phương án 73, trong đó A được chọn từ  $-ON=CH-$ ,  $-ON=C(CH_3)-$ ,  $-NHN=CH-$ ,  $-NHN=C(CH_3)-$ ,  $-N=CH-$ ,  $-N=C(CH_3)-$ ,  $-CH=NO-$ ,  $-C(CH_3)=NO-$ ,  $-CH=NNH-$ ,  $-C(CH_3)=NNH-$ ,  $-CH=N-$  và  $-C(CH_3)=N-$ .
- Phương án 75. Hợp chất theo Phương án 74, trong đó A được chọn từ  $-ON=CH-$ ,  $-ON=C(CH_3)-$ ,  $-NHN=CH-$ ,  $-NHN=C(CH_3)-$ ,  $-N=CH-$ , và  $-N=C(CH_3)-$ .
- Phương án 76. Hợp chất theo Phương án 74, trong đó A được chọn từ  $-CH=NO-$ ,  $-C(CH_3)=NO-$ ,  $-CH=NNH-$ ,  $-C(CH_3)=NNH-$ ,  $-CH=N-$  và  $-C(CH_3)=N-$ .
- Phương án 77. Hợp chất có công thức 1, trong đó  $R^{15}$  không phải là  $C_4$ - $C_8$  xycloalkylalkyl.

Các Phương án theo sáng chế, bao gồm Phương án 1 đến 77 ở trên cũng như các Phương án bất kỳ khác được mô tả ở đây, có thể được kết hợp với nhau theo cách bất kỳ, và phần mô tả các Phương án biến đổi này không chỉ đề cập đến các hợp chất có công thức có công thức 1 mà còn đề cập đến cả các hợp chất ban đầu và hợp chất trung gian được sử dụng để điều chế hợp chất có công thức 1. Ngoài ra, Phương án theo sáng chế, bao gồm các Phương án 1-77 ở trên cũng như các Phương án bất kỳ khác được mô tả ở đây, và sự kết hợp bất kỳ giữa các Phương án này, đề cập đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Sự kết hợp của các Phương án 1–77 được minh họa bằng:

Phương án A. Hợp chất có công thức 1, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{NH}-$  hoặc  $-\text{O}-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $\text{Q}^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1;

$\text{Q}^1$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$ ;

$\text{Q}^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{10}$ ;

$\text{Y}^1$  và  $\text{Y}^2$  đều là O; và

J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-$ .

Phương án B. Hợp chất có công thức 1, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{NH}-$  hoặc  $-\text{O}-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $\text{Q}^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1;

$\text{Q}^1$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$ ;

$\text{Q}^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{10}$ ;

$\text{Y}^1$  và  $\text{Y}^2$  đều là O; và

J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-\text{CR}^{2a}\text{R}^{3a}-$ .

Phương án C. Hợp chất theo Phương án A, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ;

$\text{R}^1$  là H, Me hoặc Et;

$\text{R}^2$  là H;

$\text{R}^3$  là H;

$\text{R}^4$  là H;

$\text{R}^5$  là H;

$\text{R}^6$  là H;

$\text{R}^7$  độc lập là độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  xyanoalkyl,

$\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  xyanoalkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$

haloalkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkynyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkynyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  nitroalkyl,  $\text{C}_2$ –

$\text{C}_8$  nitroalkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$

haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  xycloalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_4$ – $\text{C}_{10}$

xycloalkylalkyl,  $\text{C}_4$ – $\text{C}_{10}$  alkylxycloalkyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$

haloalkoxy,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkenyloxy,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkenyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$

alkynyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  haloalkynyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  xycloalkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$

alkylthio,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylthio,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylsulfinyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$

haloalkylsulfinyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylsulfonyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylsulfonyl,

hydroxy, formyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkylcarbonyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkylcarbonyloxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$

alkylsulfonyloxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_4$

alkylamino,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_4$  dialkylamino, formylamino,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_4$

alkylcarbonylamino,  $-\text{SF}_5$ ,  $-\text{SCN}$ ,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_{12}$  trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl

hoặc trimethylsilylmetoxy; và

$R^{10}$  độc lập là halogen, xyano, nitro,  $C_1$ – $C_2$  alkyl,  $C_1$ – $C_3$  haloalkyl hoặc  $C_1$ – $C_3$  alkylsulfonyl.

Phương án D. Hợp chất theo Phương án B, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ;

$R^1$  là H, Me hoặc Et;

$R^2$  là H;

$R^3$  là H;

$R^{2a}$  là H;

$R^{3a}$  là H;

$R^4$  là H;

$R^5$  là H;

$R^6$  là H;

$R^7$  độc lập là độc lập là halogen, xyano, nitro,  $C_1$ – $C_8$  alkyl,  $C_2$ – $C_8$  xyanoalkyl,  $C_1$ – $C_8$  xyanoalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkenyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkynyl,  $C_1$ – $C_8$  nitroalkyl,  $C_2$ – $C_8$  nitroalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  alkylxycloalkyl,  $C_1$ – $C_8$  alkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  alkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyloxy,  $C_3$ – $C_8$  alkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  haloalkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylthio,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylthio,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $C_1$ – $C_4$  alkylamino,  $C_2$ – $C_4$  dialkylamino, formylamino,  $C_2$ – $C_4$  alkylcarbonylamino,  $-\text{SF}_5$ ,  $-\text{SCN}$ ,  $C_3$ – $C_{12}$  trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; và

$R^{10}$  độc lập là halogen, xyano, nitro,  $C_1$ – $C_2$  alkyl,  $C_1$ – $C_3$  haloalkyl hoặc  $C_1$ – $C_3$  alkylsulfonyl.

Phương án E. Hợp chất theo Phương án C, trong đó:

mỗi  $R^7$  độc lập là halogen, xyano,  $C_1$ – $C_2$  alkyl,  $C_1$ – $C_3$  haloalkyl hoặc  $C_1$ – $C_3$  alkylsulfonyl; và

mỗi  $R^{10}$  độc lập là halogen hoặc  $C_1$ – $C_2$  haloalkyl.

Phương án F. Hợp chất theo Phương án E trong đó

$Q^1$  là vòng phenyl được thế bằng 1 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ ;

$Q^2$  là vòng phenyl có 2 phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và một trong số các phần tử thế này là ở vị trí ortho và phần tử thế khác nêu trên là ở vị trí meta hoặc para.

Phương án G. Hợp chất theo Phương án E, trong đó:

$Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng ba phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và ba phần tử thế là ở vị trí ortho, meta và para positions của vòng phenyl.

Phương án H. Hợp chất có công thức 1, trong đó:

A được chọn từ  $-\text{ON}=\text{CH}-$ ,  $-\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{NHN}=\text{CH}-$ ,  $-\text{NHN}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{N}=\text{CH}-$ ,  $-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}=\text{NO}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NO}-$ ,  $-\text{CH}=\text{NNH}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NNH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{N}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CF}_2-$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$ ,  $-\text{SO}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{NH}-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$  và  $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2-$ , trong đó liên kết hướng về phía trái được liên kết với nhóm  $\text{Q}^1$ , và liên kết hướng về phía phải được liên kết với phần còn lại của công thức 1;

$\text{Q}^1$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$ ; hoặc vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $\text{R}^9$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng;

$\text{Q}^2$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{10}$ ; hoặc vòng dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn có 5 đến 6 cạnh, mỗi vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{11}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $\text{R}^{11}$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng;

$\text{Y}^1$  và  $\text{Y}^2$  đều là O;

$\text{R}^1$  là H, hydroxy, amino, xyano, formyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  alkylcarbonylalkyl,  $-\text{C}(\text{C}_1\text{--C}_4\text{ alkyl})=\text{N}-\text{O}(\text{C}_1\text{--C}_4\text{ alkyl})$ ,  $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ,  $\text{C}_1\text{--C}_6$  alkyl,  $\text{C}_1\text{--C}_6$  haloalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_6$  alkenyl,  $\text{C}_3\text{--C}_6$  alkynyl,  $\text{C}_2\text{--C}_6$  xyanoalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_6$  xycloalkyl,  $\text{C}_4\text{--C}_8$  xycloalkylalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl hoặc  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkoxyalkyl;

$\text{R}^6$  là H, hydroxy, amino,  $\text{C}_1\text{--C}_6$  alkyl,  $\text{C}_1\text{--C}_6$  haloalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_6$  alkenyl,  $\text{C}_3\text{--C}_6$  alkynyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl hoặc  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkoxyalkyl;

mỗi  $\text{R}^7$  độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  alkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  xyanoalkyl,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  xyanoalkoxy,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  haloalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkenyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkenyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkynyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkynyl,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  nitroalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  nitroalkenyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  xycloalkyl,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_4\text{--C}_{10}$  xycloalkylalkyl,  $\text{C}_4\text{--C}_{10}$  alkylxycloalkyl,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  alkoxy,  $\text{C}_1\text{--C}_8$  haloalkoxy,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  alkenyloxy,  $\text{C}_2\text{--C}_8$  haloalkenyloxy,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  alkynyloxy,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  haloalkynyloxy,  $\text{C}_3\text{--C}_8$  xycloalkoxy,  $\text{C}_1\text{--C}_8$

alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> dialkylamino, formylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkylcarbonylamino, -SF<sub>5</sub>, -SCN, C<sub>3</sub>–C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; và

mỗi R<sup>10</sup> độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl.

Các Phương án đặc biệt bao gồm hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm bao gồm:

N-(2,3-diflophenyl)-4-[(4-flophenyl)metyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxamit (Hợp chất 13); và

4-[(3-clophenyl)metyl]-N-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-3-pyrolidincarboxamit (Hợp chất 1).

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp phòng trừ thực vật không mong muốn bao gồm bước đưa vào vị trí của thực vật lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả ở đây). Được ưu tiên là các phương án đề cập đến các phương pháp sử dụng là các phương án bao gồm các hợp chất theo các phương án được mô tả trên đây. Hợp chất theo sáng chế đặc biệt hữu ích để phòng trừ chọn lọc cỏ dại ở cây trồng như lúa mì, lúa mạch, ngô, đậu tương, hoa hướng dương, bông, cải dầu và lúa, và cây trồng đặc sản như mía, cam quýt, cây ăn quả và cây lấy hạt.

Cũng đáng lưu ý là các phương án về chế phẩm diệt cỏ theo sáng chế chứa hợp chất theo các phương án được mô tả trên đây.

Sáng chế cũng bao gồm hỗn hợp diệt cỏ chứa (a) hợp chất được chọn từ Công thức 1, N-oxit, và các muối của chúng, và (b) ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ (b1) chất ức chế quang hệ II, (b2) chất ức chế synthaza của axit axetohydroxy (AHAS), (b3) chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza (ACCaza), (b4) chất đẳng hiệu auxin, (b5) chất ức chế 5 enol-pyruvylshikimat-3-phosphat (EPSP) syntaza, (b6) chất phân chia điện tử quang hệ I, (b7) chất ức chế protoporphyrinogen oxidaza (PPO), (b8) chất ức chế glutamin synthetaza (GS), (b9) chất ức chế elongaza của axit béo mạch rất dài (VLCFA), (b10) chất ức chế vận chuyển auxin, (b11) chất ức chế phytoen desaturaza (PDS), (b12) chất ức chế 4-hydroxyphenyl pyruvat dioxyaza (HPPD), (b13) chất ức chế homogentisat solenesyltranseraza (HST), (b14) chất ức chế sinh tổng hợp xenluloza, (b15) thuốc diệt cỏ khác bao gồm chất phá vỡ quá trình nguyên phân, hợp chất asen hữu cơ, asulam, bromobutit, xinmetylin, cumyluron, dazomet, difenzoquat, dymron, etobenzanit, flurenol, fosamin, fosamin-amoni, metam,

metyldymron, axit oleic, oxaziclomefon, axit pelargonic và pyributicarb, và (b16) chất an toàn diệt cỏ (safener); và các muối của các hợp chất từ (b1) đến (b16).

“Chất ức chế quang hệ II” (b1) là các hợp chất hoá học gắn kết với protein D-1 ở vách gắn kết Q<sub>B</sub> và do đó phong bế vận chuyển điện tử từ Q<sub>A</sub> đến Q<sub>B</sub> trong màng thylakoit lục lạp. Các điện tử bị phong bế đi qua quang hệ II được chuyển qua một loạt các phản ứng để tạo ra các hợp chất độc phá vỡ màng tế bào và gây hiện tượng phồng lục lạp, rò rỉ màng, và cuối cùng là phá vỡ cấu trúc tế bào. Vách gắn kết Q<sub>B</sub> có ba vị trí gắn kết khác nhau: vị trí gắn kết A gắn kết triazin như atrazin, triazinon như hexazinon, và uraxil như bromaxil, vị trí gắn kết B gắn kết phenylure như điuon, và vị trí gắn kết C gắn kết benzothiadiazol như bentazon, nitril như bromoxynil và phenyl-pyridazin như pyridat. Ví dụ về chất ức chế quang hệ II bao gồm ametryn, amicarbazon, atrazin, bentazon, bromaxil, bromofenoxim, bromoxynil, clobromuron, cloridazon, clotoluron, cloxuron, cumyluron, xyanazin, daimuron, desmedipham, desmetryn, dimefuron, dimetametryn, điuon, ethidimuron, fenuron, fluometuron, hexazinon, ioxynil, isoproturon, isouron, lenaxil, linuron, metamitron, metabenzthiazuron, metobromuron, metoxuron, metribuzin, monolinuron, neburon, pentanoclo, phenmedipham, prometon, prometryn, propanil, propazin, pyridafol, pyridat, siduron, simazin, simetryn, tebuthiuron, terbacil, terbumeton, terbutylazin, terbutryn và trietazin. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với atrazin, bromoxynil hoặc metribuzin.

“Chất ức chế AHAS” (b2) là các hợp chất hoá học ức chế synthaza của axit axetohydroxy (AHAS), còn gọi là axetolactat synthaza (ALS), và do đó diệt thực vật bằng cách ức chế quá trình tạo thành axit amin béo mạch nhánh như valin, leuxin và isoleuxin, cần cho quá trình tổng hợp protein và sinh trưởng tế bào. Ví dụ về chất ức chế AHAS bao gồm amitosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron-metyl, bispribac-natri, cloransulam-metyl, clorimuron-etyl, closulfuron, xinosulfuron, xyclosulfamuron, diclosulam, etametsulfuron-metyl, etoxysulfuron, flazasulfuron, florasulam, flucarbazon-natri, flumetsulam, flupyrsulfuron-metyl, flupyrsulfuron-natri, foramsulfuron, halosulfuron-metyl, imazametabenz-metyl, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazetapyr, imazosulfuron, iodosulfuron-metyl (bao gồm muối natri), iofensulfuron (2-iodo-*N*-[(4-methoxy-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)amino]-carbonyl]benzensulfonamit), mesosulfuron-metyl, metazosulfuron (3-clo-4-(5,6-dihydro-5-metyl-1,4,2-dioxazin-3-yl)-*N*-[(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]-carbonyl]-1-metyl-1*H*-pyrazol-5-sulfonamit), metosulam, metsulfuron-metyl, nicosulfuron, oxasulfuron, penoxsulam, primisulfuron-metyl, propoxycarbazon-natri, propyrisulfuron (2-clo-*N*-[(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonyl]-6-propylimidazo[1,2-*b*]pyridazin-3-sulfonamit), prosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyribenzoxim, pyriftalit, pyriminobac-metyl, pyriothiobac-natri, rimsulfuron, sulfometuron-metyl, sulfosulfuron, thiencarbazon, thifensulfuron-metyl, triafamon (*N*-[2-[(4,6-dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)carbonyl]-6-flophenyl]-1,1-diflo-*N*-metylmetansulfonamit), triasulfuron, tribenuron-metyl, trifloxysulfuron (bao gồm

muối natri), triflurosulfuron-metyl và tritosulfuron. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với nicosulfuron, flupyrsulfuron hoặc clorimuron.

“Chất ức chế ACCaza” (b3) là các hợp chất hoá học ức chế enzym axetyl CoA carboxylaza, chịu trách nhiệm xúc tác bước sớm trong quá trình tổng hợp lipid và axit béo ở thực vật. Lipid là hợp phần thiết yếu của màng tế bào, và không có chúng thì các tế bào mới không thể tạo ra được. Việc ức chế axetyl CoA carboxylaza và việc mất quá trình tạo ra lipid sau đó dẫn đến việc làm mất tính nguyên vẹn màng tế bào, nhất là ở các khu vực sinh trưởng tích cực như mô phân sinh. Cuối cùng, sinh trưởng chồi và thân rễ ngừng, và mô phân sinh của chồi và chồi của thân rễ bắt đầu chết trở lại. Ví dụ về chất ức chế ACCaza bao gồm aloxydim, butoxydim, clethodim, clodinafop, xycloxydim, xyhalofop, diclofop, fenoxaprop, fluazifop, haloxyfop, pinoxaden, profoxydim, propaquizafop, quizalofop, setoxydim, tepraloxymid và tralkoxydim, bao gồm các dạng phân giải như fenoxaprop-P, fluazifop-P, haloxyfop-P và quizalofop-P và các dạng este như clodinafop-propargyl, xyhalofop-butyl, diclofop-metyl và fenoxaprop-P-etyl. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với pinoxaden hoặc quizalofop.

Auxin là hormon thực vật điều hòa quá trình sinh trưởng ở nhiều mô thực vật. “Chất đẳng hiệu auxin” (b4) là các hợp chất hoá học mimicking hormon sinh trưởng thực vật auxin, do đó gây ra sự sinh trưởng mất kiểm soát và thiếu tổ chức dẫn đến chết thực vật ở các loài mẫn cảm. Ví dụ về chất đẳng hiệu auxin bao gồm aminoxyclopyraclo (axit 6-amino-5-clo-2-xyclopropyl-4-pyrimidin carboxylic) và các este metyl và etyl của nó và các muối natri và kali của nó, aminopyralit, benazolin-etyl, cloramben, clacyfos, clomeprop, clopyralit, dicamba, 2,4-D, 2,4-DB, dicloprop, floxypyr, halauxifen (axit 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxypheyl)-2-pyridincarboxylic), halauxifen-metyl (metyl 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxypheyl)-2-pyridincarboxylat), MCPA, MCPB, mecoprop, picloram, quinclorac, quinmerac, 2,3,6-TBA, triclopyr, và metyl 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxypheyl)-5-flo-2-pyridincarboxylat. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với dicamba.

“Chất ức chế EPSP syntaza” (b5) là các hợp chất hoá học ức chế enzym, 5-enol-pyruvylshikimat-3-phosphat synthaza, liên quan đến quá trình tổng hợp axit amin thơm như tyrosin, tryptophan và phenylalanin. Chất ức chế thuốc diệt cỏ EPSP được hấp thụ một cách dễ dàng qua tán lá cây và dịch chuyển trong li be đến các điểm sinh trưởng. Glyphosat là thuốc diệt cỏ sau nảy mầm tương đối không chọn lọc thuộc nhóm này. Glyphosat bao gồm các este và các muối như amoni, isopropylamoni, kali, natri (bao gồm sesquinati) và trimesium (được gọi theo cách khác là sulfosat).

“Chất phân chia điện tử quang hệ I” (b6) là các hợp chất hoá học nhận các điện tử từ quang hệ I, và sau một vài chu trình, sinh ra các gốc hydroxyl. Các gốc này cực kỳ dễ phản ứng và phá hoại một cách dễ dàng các lipid chưa bão hoà, bao gồm axit béo của màng và chất diệt lục. Điều này phá vỡ tính nguyên vẹn màng tế bào, gây “rò rỉ” các tế bào và các hạt cơ quan, dẫn đến việc lá mất nước và héo rũ nhanh, và cuối cùng

là gây chết thực vật. Ví dụ về dạng chất ức chế quang tổng hợp thứ hai này bao gồm diquat và paraquat.

“Chất ức chế PPO” (b7) là các hợp chất hoá học ức chế enzym protoporphyrinogen oxidaza, dẫn đến tạo ra một cách nhanh chóng các hợp chất có tính phản ứng cao ở thực vật làm phá vỡ màng tế bào, gây rò rỉ các chất lỏng của tế bào. Ví dụ về chất ức chế PPO bao gồm axiflofen-natri, azafenidin, benzfendizon, bifenox, butafenaxil, carfentrazon, carfentrazon-etyl, clometoxyfen, xinidon-etyl, fluazolat, flufenpyr-etyl, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, floglycofen-etyl, fluthiaxet-metyl, fomesafen, halosafen, lactofen, oxadiargyl, oxadiazon, oxyfluorfen, pentoxazon, profluazol, pyraclonil, pyraflufen-etyl, saflufenacil, sulfentrazon, thidiazimin, trifludimoxazin (dihydro-1,5-dimetyl-6-thioxo-3-[2,2,7-triflo-3,4-dihydro-3-oxo-4-(2-propyn-1-yl)-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-1,3,5-triazin-2,4(1H,3H)-dion) và tiafenacil (metyl *N*-[2-[[2-clo-5-[3,6-dihydro-3-metyl-2,6-dioxo-4-(triflometyl)-1(2H)-pyrimidinyl]-4-flophenyl]thio]-1-oxopropyl]-β-alaninat).

“Chất ức chế GS” (b8) là các hợp chất hoá học ức chế hoạt tính của enzym glutamin synthetaza, mà thực vật sử dụng để chuyển hóa amoniac thành glutamin. Tiếp theo, amoniac tích tụ và mức glutamin giảm. Hiện tượng tổn hại cho thực vật có lẽ xảy ra do tác dụng kết hợp của amoniac độc tính và sự thiếu hụt axit amin cần cho các quá trình trao đổi chất khác. Chất ức chế GS bao gồm glufosinat và các este và các muối của nó, như glufosinat-amoni và dẫn xuất phosphinothrixin khác, glufosinat-P ((2*S*)-2-amino-4-(axit hydroxymetylphosphinyl)butanoic) và bilanaphos.

“Chất ức chế VLCFA elongaza” (b9) là thuốc diệt cỏ có nhiều cấu trúc hóa học khác nhau, ức chế elongaza. Elongaza là một trong số các enzym nằm ở trong hoặc gần lục lạp liên quan đến quá trình sinh tổng hợp VLCFAs. Ở thực vật, axit béo mạch rất dài là thành phần chính của polyme kỵ nước ngăn ngừa hiện tượng khô lá ở bề mặt lá và tạo ra độ ổn định cho hạt phấn hoa. Thuốc diệt cỏ như vậy bao gồm axetoclo, alaclo, anilofos, butaclo, cafenstrol, dimetaclo, dimetenamit, diphenamit, fenoxasulfon (3-[[[(2,5-diclo-4-etoxypheyl)metyl]sulfonyl]-4,5-dihydro-5,5-dimetylisoxazol], fentrazamit, flufenaxet, indanofan, mefenaxet, metazaclo, metolaclo, naproanilit, napropamit, napropamit-M ((2*R*)-*N,N*-dietyl-2-(1-naphtalenylloxy)propanamit), pethoxamit, piperophos, pretilaclo, propaclo, propisoclo, pyroxasulfon, và thenylclo, bao gồm các dạng phân giải như *S*-metolaclo và cloaxetamit và oxyaxetamit. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với flufenaxet.

“Chất ức chế vận chuyển auxin” (b10) hóa chất ức chế vận chuyển auxin ở thực vật, như bằng cách gắn kết với protein mang auxin. Ví dụ về chất ức chế vận chuyển auxin bao gồm dflufenzopyr, naptalam (còn gọi là axit *N*-(1-naphtyl)phtalamic và axit 2-[(1-naphtalenylamino)carbonyl]benzoic).

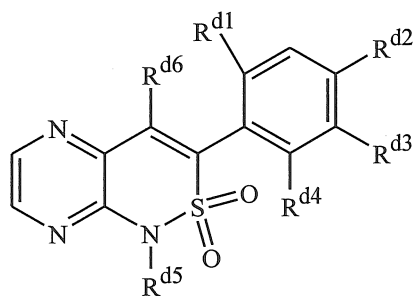
“Chất ức chế PDS” (b11) là các hợp chất hoá học ức chế sinh tổng hợp đường carotenoid ở bước phytoen desaturaza. Ví dụ về chất ức chế PDS bao gồm beflubutamit, dflufenican, fluridon, flocloidon, flurtamon norflurzon và picolinafen.

“Chất ức chế HPPD” (b12) là hóa chất ức chế sinh tổng hợp quá trình tổng hợp 4-hydroxyphenyl-pyruvat dioxyaza. Ví dụ về chất ức chế HPPD bao gồm

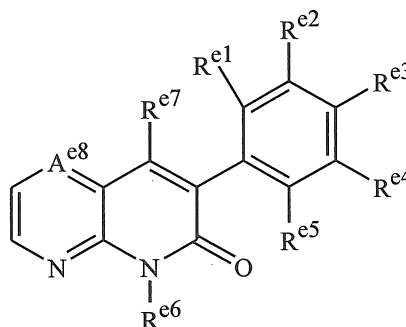
benzobixyclon, benzofenap, bixyclopyron (4-hydroxy-3-[[2-[(2-metoxymethoxy)methyl]-6-(trifluoromethyl)-3-pyridinyl]carbonyl]bicyclo[3,2,1]oct-3-en-2-on), fenquino-trion (2-[[[8-clo-3,4-dihydro-4-(4-metoxiphenyl)-3-oxo-2-quinoxaliny]carbonyl]-1,3-xyclohexandion), isoxaclo-tol, isoxaflutol, mesotri-on, pyrasulfotol, pyrazolynat, pyrazoxyfen, sulcotri-on, tefuryltrion, tembotri-on, tolpyralat (1-[[1-etyl-4-[3-(2-metoxymethoxy)-2-metyl-4-(metylsulfonyl)benzoyl]-1H-pyrazol-5-yl]oxy]etyl metyl carbonat), topramezon, 5-clo-3-[(2-hydroxy-6-oxo-1-xyclohexen-1-yl)carbonyl]-1-(4-metoxiphenyl)-2(1*H*)-quinoxalinon, 4-(2,6-dietyl-4-metylphenyl)-5-hydroxy-2,6-dimetyl-3(2*H*)-pyridazinon, 4-(4-flophenyl)-6-[(2-hydroxy-6-oxo-1-xyclohexen-1-yl)carbonyl]-2-metyl-1,2,4-triazin-3,5(2*H*,4*H*)-dion, 5-[(2-hydroxy-6-oxo-1-xyclohexen-1-yl)carbonyl]-2-(3-metoxiphenyl)-3-(3-metoxipropyl)-4(3*H*)-pyrimidinon, 2-metyl-*N*-(4-metyl-1,2,5-oxadiazol-3-yl)-3-(metylsulfinyl)-4-(trifluorometyl)benzamid và 2-metyl-3-(metylsulfonyl)-*N*-(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)-4-(trifluorometyl)benzamid. Được ưu tiên là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với mesotri-on hoặc pyrasulfatol.

Chất ức chế HST (b13) phá vỡ khả năng của thực vật chuyển hóa homogentisat thành 2-metyl-6-solanyl-1,4-benzoquinon, nhờ đó phá vỡ quá trình sinh tổng hợp carotenoid. Ví dụ về chất ức chế HST bao gồm haloxydin, xyclopyrimorat (6-clo-3-(2-xyclopropyl-6-metylphenoxy)-4-pyridazinyl 4-morpholincarboxylat), pyriclor, 3-(2-clo-3,6-diflophenyl)-4-hydroxy-1-metyl-1,5-naphtyridin-2(1*H*)-on, 7-(3,5-diclo-4-pyridinyl)-5-(2,2-difloetyl)-8-hydroxypyrido[2,3-*b*]pyrazin-6(5*H*)-on và 4-(2,6-dietyl-4-metylphenyl)-5-hydroxy-2,6-dimetyl-3(2*H*)-pyridazinon.

Chất ức chế HST cũng bao gồm hợp chất có công thức A và B.



A



B

trong đó  $R^{d1}$  là H, Cl hoặc  $CF_3$ ;  $R^{d2}$  là H, Cl hoặc Br;  $R^{d3}$  là H hoặc Cl;  $R^{d4}$  là H, Cl hoặc  $CF_3$ ;  $R^{d5}$  là  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$  hoặc  $CH_2CHF_2$ ; và  $R^{d6}$  là OH, hoặc  $-OC(=O)-i-Pr$ ; và  $R^{e1}$  là H, F, Cl,  $CH_3$  hoặc  $CH_2CH_3$ ;  $R^{e2}$  là H hoặc  $CF_3$ ;  $R^{e3}$  là H,  $CH_3$  hoặc  $CH_2CH_3$ ;  $R^{e4}$  là H, F hoặc Br;  $R^{e5}$  là Cl,  $CH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$  hoặc  $CH_2CH_3$ ;  $R^{e6}$  là H,  $CH_3$ ,  $CH_2CHF_2$  hoặc  $C\equiv CH$ ;  $R^{e7}$  là OH,  $-OC(=O)Et$ ,  $-OC(=O)-i-Pr$  hoặc  $-OC(=O)-t-Bu$ ; và  $A^{e8}$  là N hoặc CH.

“Chất ức chế sinh tổng hợp xenluloza” (b14) ức chế quá trình sinh tổng hợp xenluloza ở các thực vật nhất định. Chúng hiệu quả nhất khi sử dụng trước phun hoặc

sau phun giai đoạn sớm trên thực vật non hoặc thực vật sinh trưởng nhanh. Ví dụ về chất ức chế sinh tổng hợp xenluloza bao gồm clothiamit, diclobenil, flupoxam, indaziflam ( $N^2$ -[(1*R*,2*S*)-2,3-dihydro-2,6-dimetyl-1*H*-inden-1-yl]-6-(1-floetyl)-1,3,5-triazin-2,4-điamin), isoxaben và triaziflam.

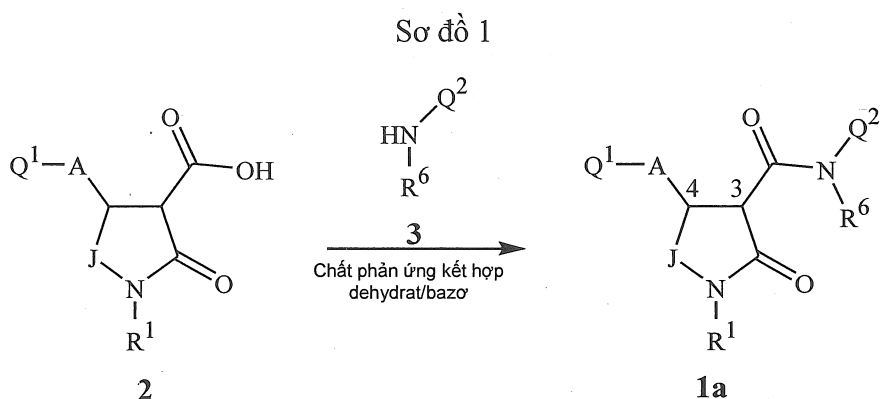
“Thuốc diệt cỏ khác” (b15) bao gồm thuốc diệt cỏ tác động thông qua nhiều kiểu tác động khác nhau như chất phá vỡ quá trình nguyên phân (ví dụ, flamprop-M-metyl và flamprop-M-isopropyl), hợp chất asen hữu cơ (ví dụ, DSMA, và MSMA), chất ức chế 7,8-dihydropteroat synthaza, chất ức chế tổng hợp isoprenoit lục lạp và chất ức chế sinh tổng hợp thành tế bào. Thuốc diệt cỏ khác bao gồm các thuốc diệt cỏ có kiểu tác động chưa biết hoặc không nằm trong một tiêu chí cụ thể được liệt kê trong (b1) đến (b14) hoặc tác động thông qua kết hợp các kiểu tác động nêu trên. Ví dụ về thuốc diệt cỏ khác bao gồm aclonifen, asulam, amitrol, bromobutit, xinmetylin, clomazon, cumyluron, daimuron, difenzoquat, etobenzanit, fluometuron, flurenol, fosamin, fosamin-amoni, dazomet, dymron, ipfencarbazon (1-(2,4-diclophenyl)-*N*-(2,4-diflophenyl)-1,5-dihydro-*N*-(1-metyletyl)-5-oxo-4*H*-1,2,4-triazol-4-carboxamit), metam, metyldymron, axit oleic, oxaziclomefon, axit pelargonic, pyributicarb và 5-[[[(2,6-diflophenyl)methoxy]metyl]-4,5-dihydro-5-metyl-3-(3-metyl-2-thienyl)isoxazol.

“Chất an toàn diệt cỏ (safener)” (b16) là các chất được bổ sung vào chế phẩm diệt cỏ để khử bỏ hoặc làm giảm tác dụng gây độc thực vật của thuốc diệt cỏ đối với các cây trồng nhất định. Các hợp chất này bảo vệ cây trồng khỏi tổn thương bởi thuốc diệt cỏ nhưng thường không ngăn ngừa được thuốc diệt cỏ phòng trừ thực vật không mong muốn. Ví dụ về chất an toàn diệt cỏ (safener) bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, benoxacor, cloquintocet-mexyl, cumyluron, xyometrinil, cyprosulfamit, daimuron, diclomit, dixyclonon, dimepiperat, fencloazol-etyl, fenclozim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen-etyl, mefenpyr-dietyl, mephenat, metoxyphenon, anhydrit naphtalic, oxabetrinil, *N*-(aminocarbonyl)-2-metylbenzensulfonamit và *N*-(aminocarbonyl)-2-flobenzensulfonamit, 1-bromo-4-[(clometyl)sulfonyl]benzen, 2-(diclometyl)-2-metyl-1,3-dioxolan (MG 191), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azospiro-[4,5]đecan (MON 4660), 2,2-diclo-1-(2,2,5-trimetyl-3-oxazolidinyl)-etanon and 2-metoxi-*N*-[[4-[[[(metylaminocarbonyl)amino]phenyl]sulfonyl]-benzamidit.

Hợp chất có công thức 1 có thể được điều chế bằng các phương pháp chung đã biết trong lĩnh vực hoá hữu cơ tổng hợp. Một hoặc nhiều phương pháp và biến thể của nó được mô tả sau đây trong các Sơ đồ 1–19 có thể được sử dụng để điều chế hợp chất có Công thức 1. Các định nghĩa về  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $Q^1$ ,  $Q^2$ ,  $J$ ,  $A$ ,  $Y^1$ , và  $Y^2$  trong hợp chất có công thức 1 đến 19 dưới đây là như được xác định trên đây trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, trừ khi có quy định khác. Các công thức 1A, 1B, 1Aa, 1Ab, 1Ba, 1Bb, 1c, 1d, 1e, 1f, 1g, 1g', 1h and, 2', 4a, 4b, 5a và, 5b, 5c, 5d, 5a', 5b', 7a, 7b, 8a, 8b, 10a và 10b là các nhóm công thức phụ khác nhau của lần lượt hợp chất có công thức 1, 2, 4, 5, 7, 8 và 10.

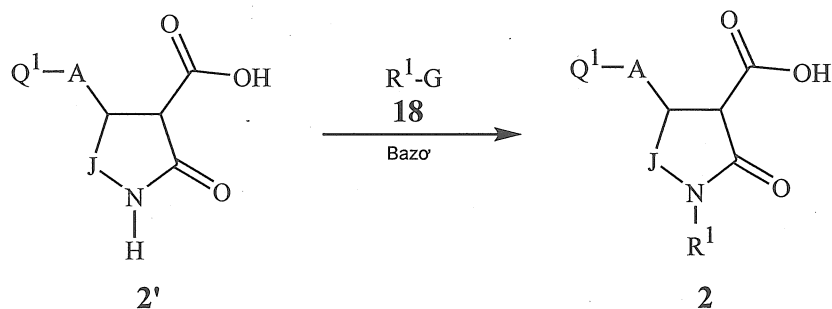
Như được thể hiện trong Sơ đồ 1, hợp chất có công thức 1A (tức là Công thức 1 trong đó  $R^1$ ,  $R^4$  và  $R^5$  là H, và  $Y^1$  và  $Y^2$  là O) có thể được điều chế bằng cách cho các axit có công thức 2 phản ứng với amin có công thức 3 với sự có mặt của chất phản

ứng ngẫu hợp khử hydrat hóa như anhydrit propylphosphonic, dicyclohexylcarbodiimide, *N*-(3-dimethylaminopropyl)-*N'*-ethylcarbodiimide, *N,N*-carbonyldiimidazole, 2-clo-1,3-dimetylimidazoli clorua hoặc 2-clo-1-metylpýridinium iotua. Chất phản ứng nền polyme, như xyclohexylcarbodiimide nền polyme, cũng thích hợp. Các phản ứng này thường vận hành ở các nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 đến 60°C trong dung môi như diclometan, axetonitril, *N,N*-dimetylformamit hoặc etyl axetat với sự có mặt của bazơ như trietylamin, *N,N*-diisopropylamin, hoặc 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en. Xem *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900–906 về các điều kiện ngẫu hợp dùng anhydrit propylphosphonic. Phương pháp theo Sơ đồ 1 được minh họa bằng Bước E của Ví dụ tổng hợp 1 và Bước D của Ví dụ tổng hợp 2.



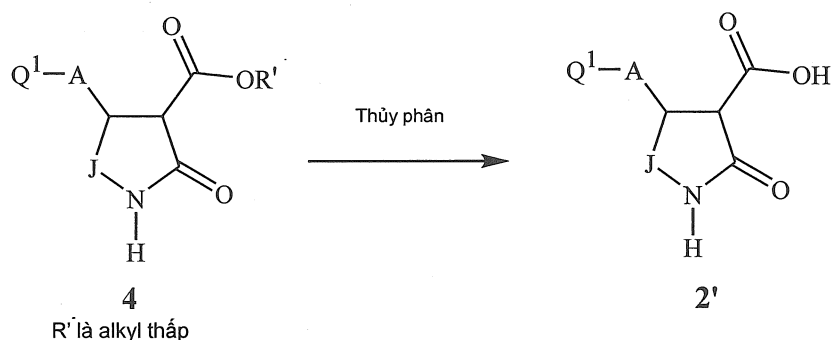
Như được thể hiện trong Sơ đồ 2, hợp chất có công thức 2 có thể được điều chế nhờ phản ứng của hợp chất có công thức 2' với chất ái điện tử tương ứng có công thức 18 với sự có mặt của bazơ. Trong công thức 18, G là nhóm rời chuyển, tức là chất tách nhân. Tùy thuộc vào việc chọn lọc R<sup>1</sup>, các ái điện tử thích hợp cho phản ứng có thể bao gồm alkyl halogenua như clorua, bromua và iotua, alkylsulfonat, axit anhydrit như *tert*-butoxycarbonyl anhydrit và axetic anhydrit, và haloalkylsilan như clotrimetylsilan. Các bazơ thích hợp cho phản ứng bao gồm bazơ vô cơ như kiềm hoặc kim loại kiềm thổ (ví dụ, lithi, natri, kali và xesi) hydroxit, alkoxit, carbonat, và phosphat, và bazơ hữu cơ như trietylamin, *N,N*-diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en. Một loạt các dung môi thích hợp để phản ứng bao gồm, ví dụ, nhưng không chỉ giới hạn ở, tetrahydrofuran, diclometan, *N,N*-dimetylformamit, *N,N*-dimetylaxetamit, *N*-metylpyrolitinon, axetonitril, rượu C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> và axeton cũng như hỗn hợp của các dung môi này. Phản ứng này được tiến hành ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ –20 đến 200°C, và thông thường là nằm trong khoảng từ 0 đến 50°C.

## Sơ đồ 2



Như được thể hiện trong Sơ đồ 3, hợp chất có công thức 2' có thể được điều chế bằng cách thủy phân este có công thức 4. Bước thủy phân được thực hiện bằng dung dịch nước bazơ hoặc dung dịch nước axit, thường là với sự có mặt của đồng dung môi. Bazơ thích hợp đối với phản ứng này bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở, hydroxit như natri và kali hydroxit và carbonat như natri và kali carbonat. Axit thích hợp đối với phản ứng này bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở, các axit vô cơ như axit clohydric, axit bromhydric và axit sulfuric, và các axit hữu cơ như axit axetic và axit trifloaxetic. Một loạt đồng dung môi khác nhau thích hợp đối với phản ứng này bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở, metanol, etanol và tetrahydrofuran. Phản ứng này được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ  $-20^{\circ}\text{C}$  đến điểm sôi của dung môi, và thường là từ 0 đến  $100^{\circ}\text{C}$ . Phương pháp của Sơ đồ 3 được minh họa bằng Bước D của Ví dụ tổng hợp 1 và Bước D của Ví dụ tổng hợp 2.

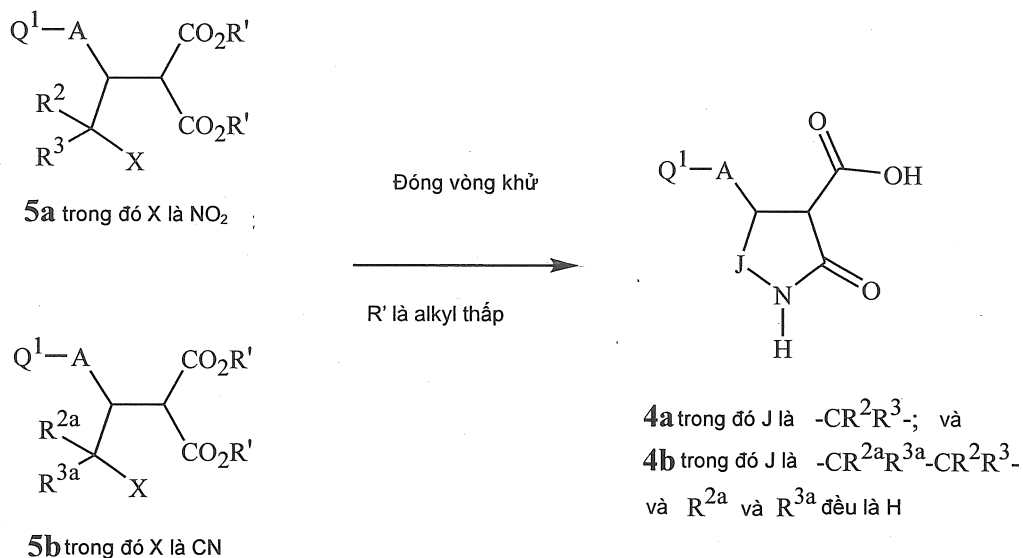
## Sơ đồ 3



Như được thể hiện trong Sơ đồ 4, hợp chất có công thức 4a hoặc 4b có thể thu được bằng cách khử hợp chất có công thức 5a hoặc 5b một cách tương ứng và tiếp theo đóng vòng tại chỗ amin trung gian thu được. Một loạt phương pháp khác nhau để khử nitro béo hoặc nhóm nitril trong hợp chất có công thức 5a hoặc 5b là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Các phương pháp này bao gồm bước hydro hóa xúc tác với sự có mặt của paladi trên cacbon hoặc niken Raney, sắt hoặc kẽm trong môi trường axit (xem, ví dụ, *Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft* 1904, 37, 3520–3525), và lithi nhôm hydrit. Quá trình khử có thể cũng đạt được với samari (II) iodua với sự có mặt của nguồn proton như metanol (xem, ví dụ, *Tetrahedron Letters* 1991, 32 (14),

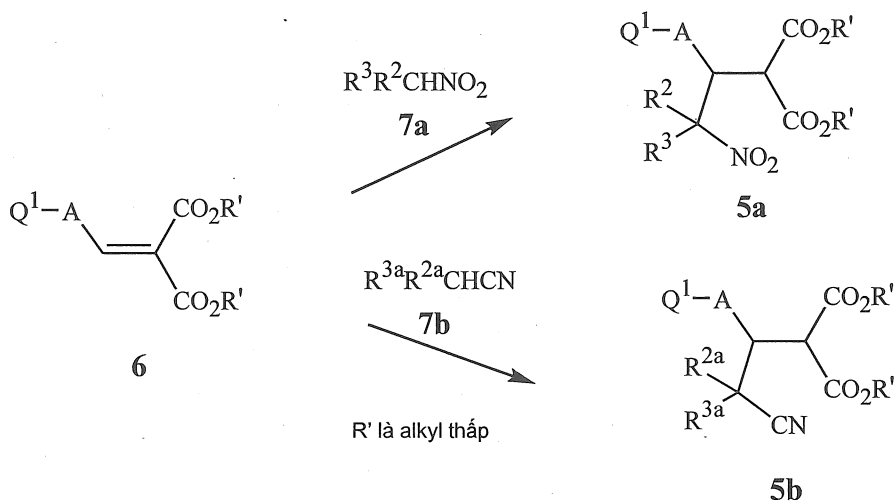
1699–1702). Theo cách khác, natri borohydrua với sự có mặt của chất xúc tác ni-ken như ni-ken (II) axetat hoặc ni-ken (II) clorua có thể được sử dụng (xem, ví dụ, *Tetrahedron Letters* 1985, 26 (52), 6413–6416). Phương pháp theo Sơ đồ 4 sử dụng natri borohydrua với sự có mặt của ni-ken (II) axetat được minh họa bằng Bước C của Ví dụ tổng hợp 1. Phương pháp của Sơ đồ 4 sử dụng sắt với sự có mặt của amoni clorua được minh họa bằng Bước C của Ví dụ tổng hợp 2.

Sơ đồ 4



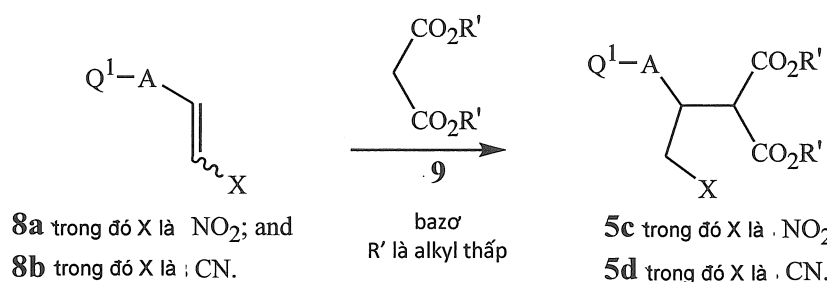
Như được thể hiện trong Sơ đồ 5, hợp chất có công thức 5a hoặc 5b có thể được điều chế bằng cách cho dieste của Công thức 6 phản ứng với nitroalkan có công thức 7a hoặc nitril có công thức 7b một cách tương ứng, thường với sự có mặt của bazơ. Các bazơ thích hợp cho phản ứng bao gồm alkoxit thấp hơn của kim loại kiềm như natri metoxit trong metanol hoặc natri etoxit trong etanol. Phương pháp theo Sơ đồ 4 được minh họa bằng Bước B của Ví dụ tổng hợp 1. Hợp chất có công thức 6 có thể được điều chế một cách dễ dàng bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này, ví dụ, bằng phương pháp ngưng tụ Knoevenagel aldehyt và malonat (xem, ví dụ, G. Jones, *Organic Reactions* Volume 15, John Wiley và Sons, 1967).

Sơ đồ 5

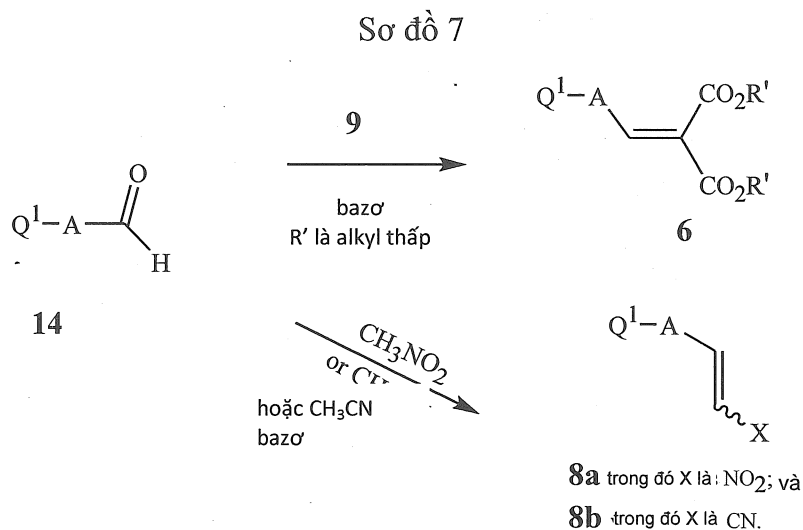


Hợp chất có công thức 5c hoặc 5d (tức là hợp chất có công thức 5a hoặc 5b, trong đó  $\text{R}^2$  và  $\text{R}^3$  là H) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức 8a hoặc 8b phản ứng với malonat có công thức 9 với sự có mặt của bazơ như được thể hiện trong Sơ đồ 6. Bazơ thích hợp cho phản ứng này bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở, alkoxit thấp hơn của kim loại kiềm như natri metoxit trong metanol hoặc natri etoxit trong etanol, hoặc các bazơ như lithi bis(trimetylsilyl)amit, natri bis(trimetylsilyl)amit và lithi diisopropylamit trong các dung môi như tetrahydrofuran. Thông thường, phản ứng được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ  $-78^\circ\text{C}$  đến  $23^\circ\text{C}$  như các điều kiện được mô tả trong Synthesis 2005, 2239–2245. Các điều kiện để thực hiện quá trình chuyển hóa này trong nước hồi lưu khi không có mặt chất xúc tác đã được báo cáo trong *Synthetic Communications* 2013, 43, 744–748.

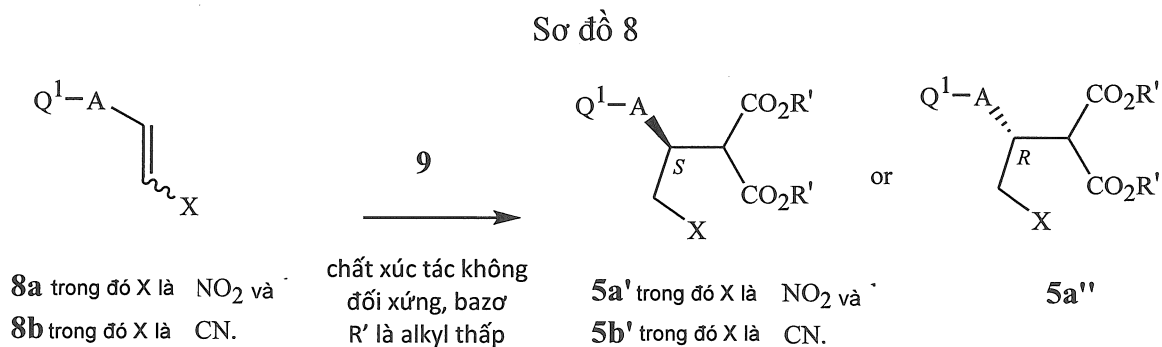
Sơ đồ 6



Hợp chất có công thức 6 có thể được điều chế dễ dàng bằng phản ứng ngưng tụ Knoevenagel aldehyt có công thức 14 và malonat có công thức 9 như được thể hiện trong Sơ đồ 7. Cũng được thể hiện trong Sơ đồ 7, hợp chất có công thức 8a và 8b có thể được điều chế bằng phản ứng ngưng tụ Knoevenagel aldehyt có công thức 14 và nitrometan hoặc axetonitril một cách tương ứng.

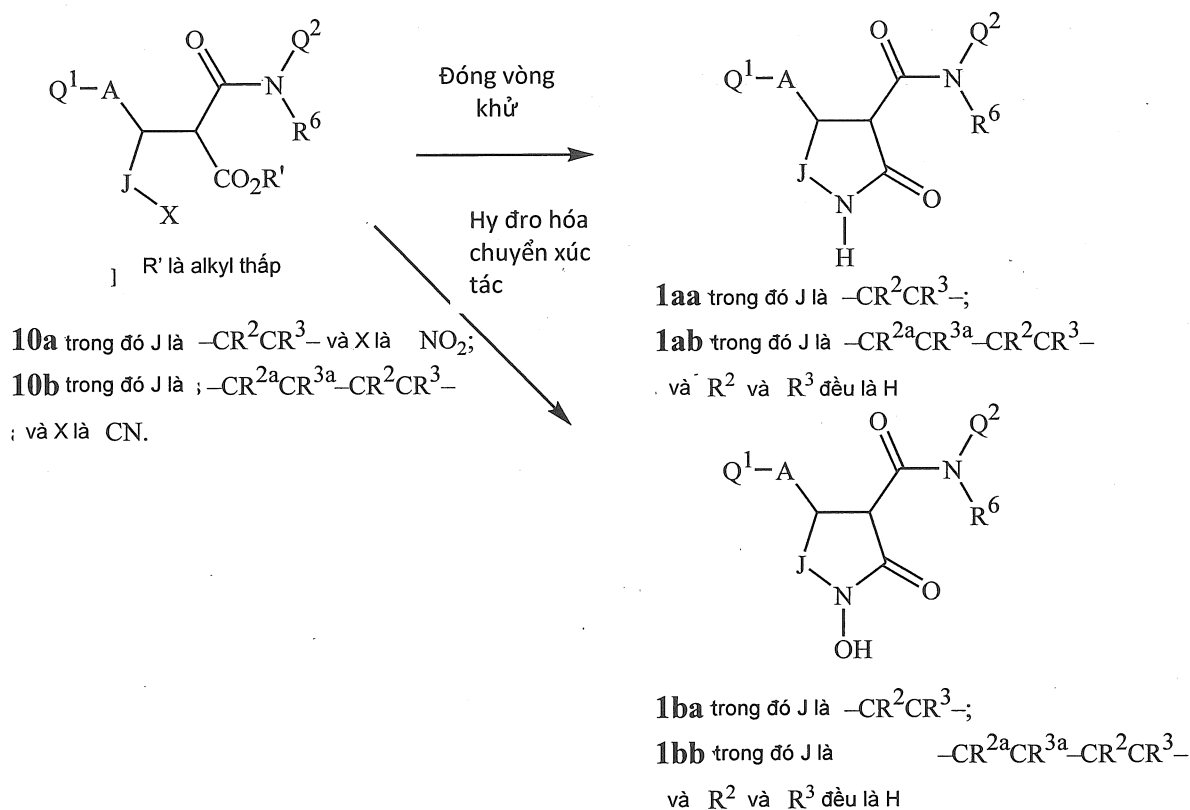


Hợp chất có công thức 5a' và 5a'' có thể được điều chế lựa chọn bằng cách cho nitroalken có công thức 8a phản ứng với malonat có công thức 9 với sự có mặt của chất xúc tác không đối xứng và tùy ý với sự có mặt của bazơ thích hợp như được thể hiện trong Sơ đồ 8. Chất xúc tác thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở Ni (II) với phối tử diamin lân cận như Ni(II) Bis[(*R,R*)-*N,N'*-dibenzylxyclohexan-1,2-diamin]dibromua, Ni(II) Bis[(*S,S*)-*N,N'*-dibenzylxyclohexan-1,2-diamin]dibromua hoặc niken (II) bromua với diamin dạng 1,1'-bi(tetrahydroisoquinolin) không đối xứng. Bazơ hữu cơ thích hợp cho phản ứng này bao gồm, nhưng không chỉ bị giới hạn ở, piperidin, morpholin, triethylamin, 4-metylmorpholin hoặc *N,N*-diisopropyletylamin. Quá trình chuyển hóa này có thể được thực hiện nguyên như thể hoặc trong các dung môi như tetrahydrofuran, toluen hoặc diclometan. Thông thường, phản ứng được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ -78°C đến 80°C sử dụng 0 đến 1 đương lượng chất xúc tác và tùy ý 0 đến 1 đương lượng bazơ. Các điều kiện để thực hiện quá trình chuyển hóa này đã được báo cáo trong *J. Am. Chem. Soc.* 2005, 9958-9959 hoặc *Eur. J. Org. Chem.* 2011, 5441-5446 về các điều kiện. Nitroalken có công thức 8a có thể được điều chế một cách dễ dàng từ aldehyt và nitrometan bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này.



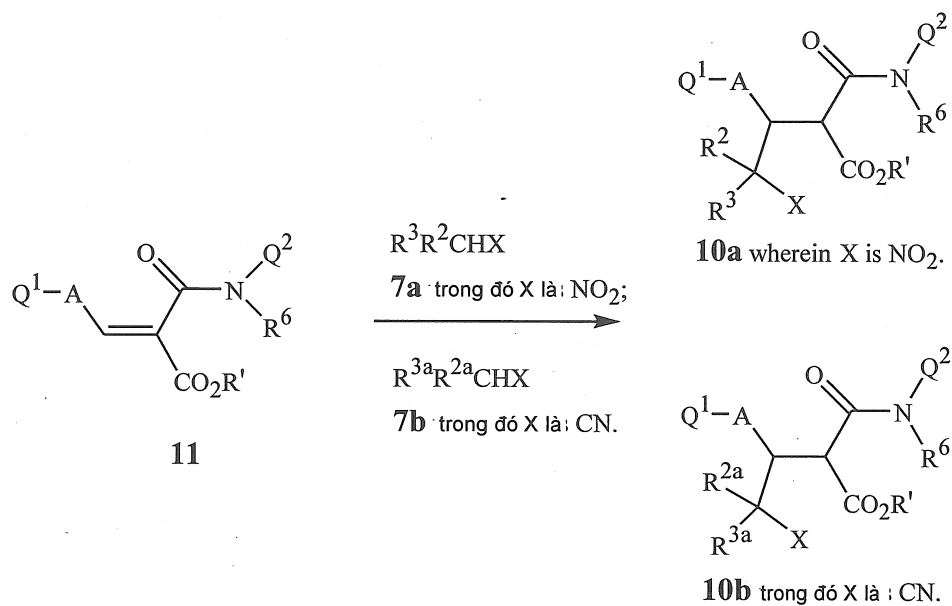
Như được thể hiện trong Sơ đồ 9, hợp chất có công thức 1Aa và 1Ab còn có thể được điều chế bằng cách đóng vòng khử hợp chất có công thức 10a và 10b tương tự với Phương pháp của Sơ đồ 4. Cũng như được thể hiện trong Sơ đồ 9, hợp chất có công thức 1Ba và 1Bb (tức là công thức 1, trong đó  $R^1$  là OH,  $R^4$  và  $R^5$  là H; và  $Y^1$  và  $Y^2$  là O) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức 10a và 10b một cách tương ứng bằng cách hydro hóa chuyển hóa bằng cách xúc tác bằng amoni format với sự có mặt của paladi trên cacbon, và tiếp theo là đóng mạch vòng tại chỗ sản phẩm trung gian hydroxylamin. Xem J. Med. Chem. 1993, 36, 1041–1047 về các điều kiện hydro hóa/đóng mạch vòng chuyển hóa bằng cách xúc tác để tạo ra N-hydroxypyrolitinon.

Sơ đồ 9



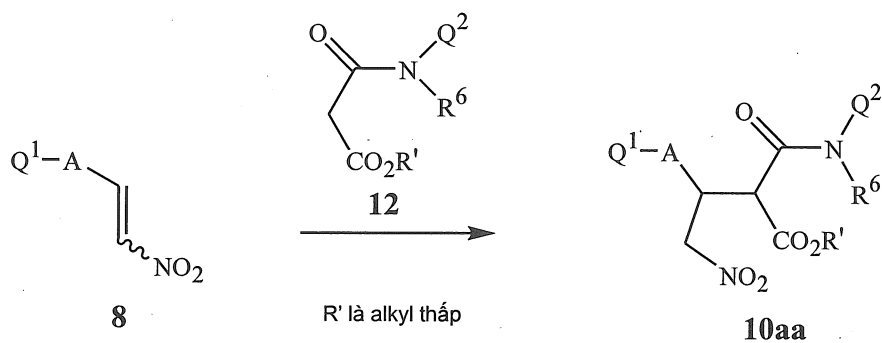
Như được thể hiện trong Sơ đồ 10, hợp chất có công thức 10a và 10b có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức 11 phản ứng với hợp chất có công thức 7a hoặc hợp chất có công thức 7b một cách tương ứng trong dung môi, với sự có mặt của bazơ tương tự với phương pháp được mô tả trong Sơ đồ 5.

## Sơ đồ 10



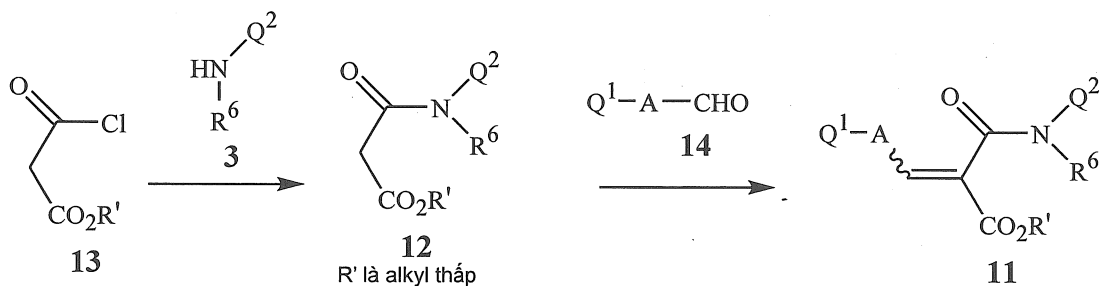
Như được thể hiện trong Sơ đồ 11, hợp chất có công thức 10aa (tức là công thức 10a trong đó R<sup>2a</sup> và R<sup>3a</sup> là H) có thể được điều chế, tương tự với Phương pháp của Sơ đồ 6, bằng cách cho nitroalken có công thức 8 phản ứng với malonat có công thức 12.

## Sơ đồ 11



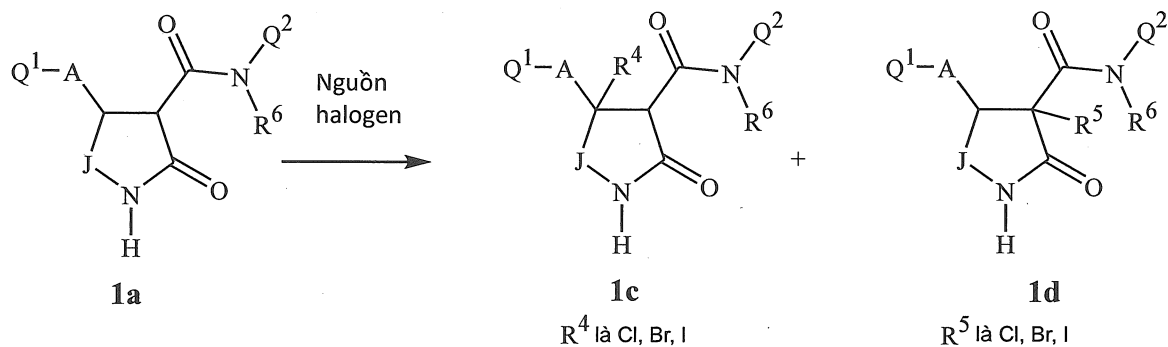
Như được thể hiện trong Sơ đồ 12, hợp chất có công thức 11 có thể được điều chế nhờ phản ứng của amit malonic có công thức 12 với aldehyt có công thức 14. Cũng như được thể hiện trong Sơ đồ 12, amit malonic có công thức 12 có thể được điều chế dễ dàng từ alkyl malonyl clorua thấp có công thức 13 như metyl malonyl clorua và amin có công thức 3.

## Sơ đồ 12



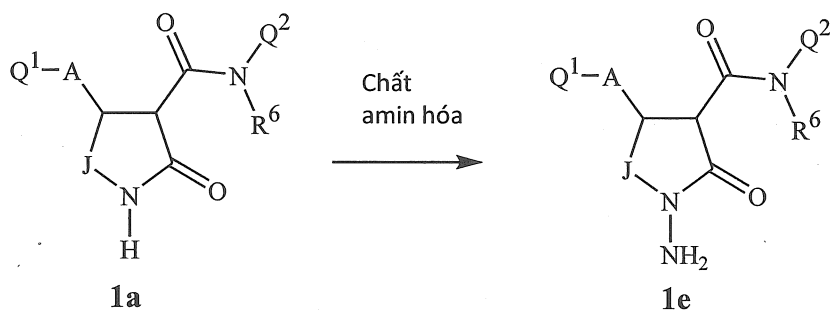
Như được thể hiện trong Sơ đồ 13, hỗn hợp của hợp chất có công thức 1c (tức là công thức 1, trong đó: R<sup>1</sup> và R<sup>5</sup> là H, R<sup>4</sup> là halogen và Y<sup>1</sup> và Y<sup>2</sup> là O) và 1d (tức là công thức 1, trong đó: R<sup>1</sup> và R<sup>4</sup> là H, R<sup>5</sup> là halogen và Y<sup>1</sup> và Y<sup>2</sup> là O) có thể được điều chế bằng cách cho phản ứng hợp chất có công thức 1A với nguồn halogen trong dung môi, với sự có mặt hoặc vắng mặt của chất khơi mào. Việc tách các chất đồng phân vùng tạo ra trong phản ứng này có thể đạt được bằng các phương pháp chuẩn như sắc ký hoặc kết tinh phân đoạn. Các nguồn halogen thích hợp cho phản ứng này bao gồm brom, clo, *N*-closucxinimit, *N*-bromosucxinimit và *N*-iodosucxinimit. Chất khơi mào thích hợp cho phản ứng này bao gồm 2,2'-azobisisobutyronitril (AIBN) và benzoyl peroxit. Thông thường, phản ứng được thực hiện trong các dung môi như diclometan nằm trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ sôi của dung môi.

## Sơ đồ 13



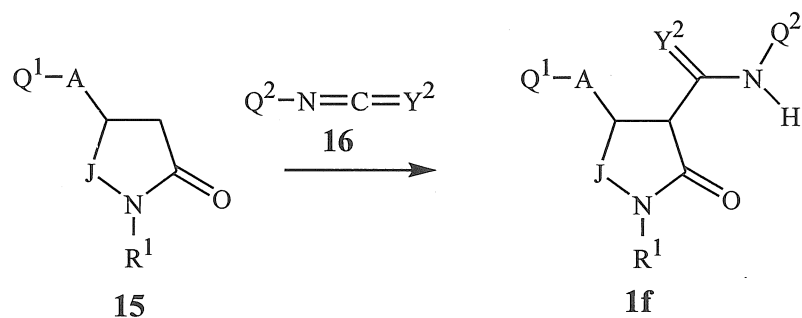
Như được thể hiện trong Sơ đồ 14, hợp chất có công thức 1e (tức là Công thức 1 trong đó R<sup>1</sup> là NH<sub>2</sub>, R<sup>4</sup> và R<sup>5</sup> là H và Y<sup>1</sup> và Y<sup>2</sup> là O) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức 1A phản ứng với chất phản ứng amin hóa như *O*-(diphenylphosphinyl)hydroxylamin và axit hydroxylamino-*O*-sulphonic. Đối với quy trình, các điều kiện và các chất phản ứng, xem *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* 2009, 19, 5924–5926 and *Journal of Organic Chemistry* 2002, 67, 6236–6239.

Sơ đồ 14



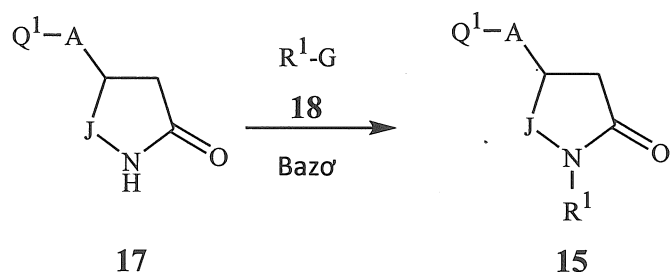
Như được thể hiện trong Sơ đồ 15, hợp chất có công thức 1f (tức là Công thức 1 trong đó  $R^4$ ,  $R^5$  và  $R^6$  là H và  $Y^1$  là O) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức 15 phản ứng với izoxyanat (tức là Công thức 16 trong đó  $Y^2$  là O) hoặc izothioxyanat (tức là Công thức 16 trong đó  $Y^2$  là S) với sự có mặt của bazơ. Ví dụ về bazơ mà có thể được sử dụng cho quy trình theo sáng chế bao gồm các quy trình được liệt kê cho phương pháp theo Sơ đồ 4. Nhiệt độ phản ứng có thể được chọn nằm trong khoảng từ  $-78^\circ\text{C}$  đến nhiệt độ sôi của dung môi được sử dụng. Thông thường, phản ứng được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ  $-78^\circ\text{C}$  đến  $100^\circ\text{C}$  trong các dung môi như toluen.

Sơ đồ 15



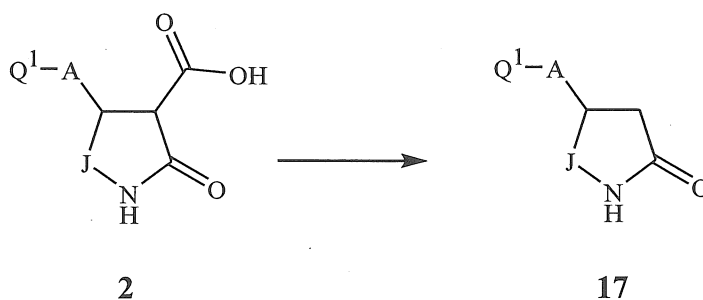
Như được thể hiện trong Sơ đồ 16, hợp chất có công thức 15 có thể được điều chế, tương tự với phương pháp được mô tả trong Sơ đồ 2, nhờ phản ứng của hợp chất có công thức 17 với chất ái điện tử tương ứng có công thức 18 với sự có mặt của bazơ.

Sơ đồ 16



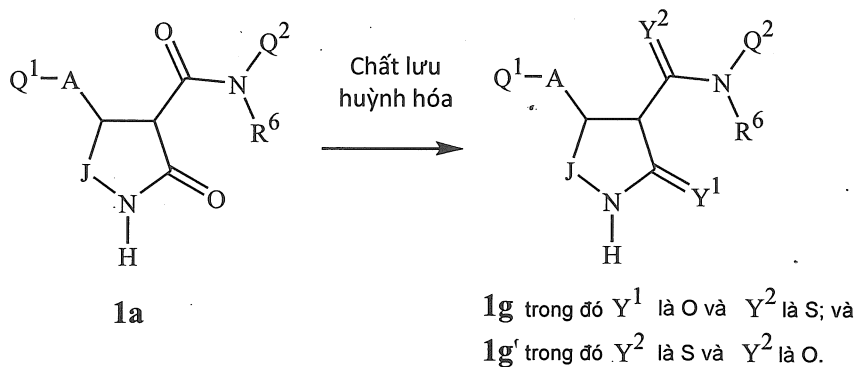
Như được thể hiện trong Sơ đồ 17, hợp chất có công thức 2 có thể được điều chế bằng cách tách nhóm carboxyl của các axit có công thức 2. Việc tách nhóm carboxyl được thực hiện bằng cách làm nóng hợp chất có công thức 2 trong dung môi, thông thường với sự có mặt của axit. Các axit thích hợp cho phản ứng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, axit *p*-toluenulfonic. Một loạt các chất đồng dung môi thích hợp cho phản ứng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, toluen, isopropanol axetat và isobutyl metylketon. Phản ứng được tiến hành ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ  $-20^{\circ}\text{C}$  và đến nhiệt độ sôi của dung môi, và thông thường là nằm trong khoảng từ 0 đến  $150^{\circ}\text{C}$ .

Sơ đồ 17



Như được thể hiện trong Sơ đồ 18, hợp chất có công thức 1g (tức là Công thức 1 trong đó  $\text{R}^1$  là H,  $\text{R}^4$  và  $\text{R}^5$  là H, và  $\text{Y}^1$  và  $\text{Y}^2$  là S) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức 1A phản ứng với ít nhất hai đương lượng chất phản ứng lưu huỳnh hóa như chất phản ứng Lawesson, tetraphospho decasulfua hoặc diphospho pentasulfua trong dung môi như tetrahydrofuran hoặc toluen. Thông thường, phản ứng được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 0 đến  $115^{\circ}\text{C}$ . Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cần hiểu rằng việc sử dụng ít hơn hai đương lượng chất phản ứng lưu huỳnh hóa có thể tạo hỗn hợp chứa sản phẩm có công thức 1 trong đó  $\text{Y}^1$  là O và  $\text{Y}^2$  là S, hoặc  $\text{Y}^1$  là S và  $\text{Y}^2$  là O, mà có thể được tách bằng các phương pháp thông thường như sắc ký và kết tinh.

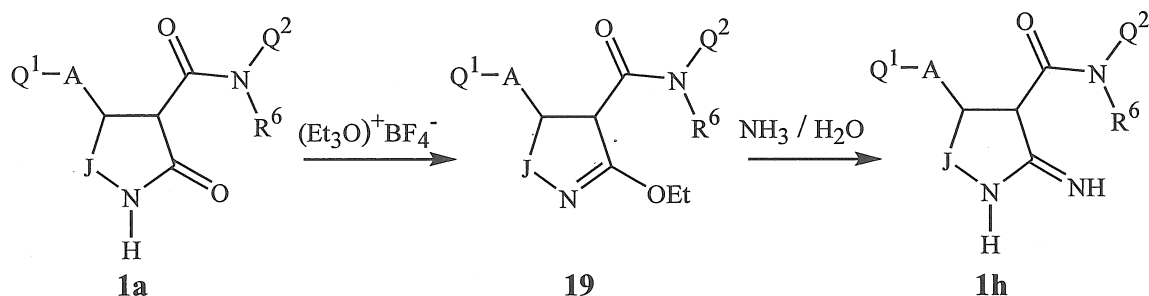
Sơ đồ 18



Như được thể hiện trong Sơ đồ 18, hợp chất có công thức 1h (tức là Công thức 1 trong đó  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^5$  là H,  $\text{Y}^2$  là O và  $\text{Y}^1$  là NH) có thể được điều chế bằng cách alkyl

hợp chất có công thức 1a trietyloxoni tetraflororat (chất phản ứng Meerwein) tiếp đó là xử lý imino ete thu được có công thức 19 bằng nước amoniac.

Sơ đồ 19



Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cần hiểu rằng các nhóm chức khác nhau có thể được chuyển hoá thành các nhóm chức khác để tạo ra các hợp chất khác nhau có công thức 1. Đối với các tài nguyên có giá trị cho thấy rằng sự hoán đổi của các nhóm chức theo kiểu dễ hiểu và đơn giản, xem Larock, R. C., *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, 1999. Ví dụ, các sản phẩm trung gian để điều chế hợp chất có công thức 1 có thể chứa nhóm nitro thom, mà có thể được khử thành nhóm amin, và tiếp theo được chuyển hóa bằng các phản ứng đã biết rõ trong lĩnh vực kỹ thuật này như phản ứng Sandmeyer, thành các halogenua khác nhau, tạo ra hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, các phản ứng nêu trên cũng có thể được thực hiện theo trình tự xen kẽ.

Cần phải hiểu rằng một số chất phản ứng và các điều kiện phản ứng được mô tả trên đây để điều chế hợp chất có công thức 1 có thể không tương hợp với một số chức có mặt trong các sản phẩm trung gian. Trong các trường hợp này, việc đưa trình tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc hoán chuyển nhóm chức vào quy trình tổng hợp sẽ giúp thu được các sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ là dễ dàng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực tổng hợp hóa học (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng như được thể hiện trong các sơ đồ riêng rẽ, có thể cần thực hiện bước tổng hợp bổ sung không được mô tả chi tiết để hoàn thành quy trình tổng hợp hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng có thể cần thực hiện kết hợp các bước được minh họa trong các Sơ đồ trên đây theo một trình tự ngoài trình tự được thể hiện cụ thể để điều chế hợp chất có công thức 1.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng hợp chất có công thức 1 và các sản phẩm trung gian được mô tả ở đây có thể tham gia vào các phản ứng ưa điện tử, ái nhân, gốc, kim loại hữu cơ, oxy hoá, và khử để bổ sung phân tử thế hoặc cải biến phân tử thế đang có.

### Ví dụ thực hiện sáng chế

Không cần mô tả chi tiết hơn, tin rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này bằng cách sử dụng phần mô tả trên đây có thể sử dụng sáng chế ở phạm vi rộng nhất của nó. Vì vậy, các Ví dụ tổng hợp sau chỉ minh họa và không giới hạn phần mô tả theo cách bất kỳ. Các bước trong các Ví dụ tổng hợp minh họa quy trình cho mỗi bước trong toàn bộ một quá trình chuyển hóa, và nguyên liệu ban đầu cho mỗi bước có thể không nhất thiết được điều chế bằng con đường điều chế cụ thể có quy trình được mô tả trong các Ví dụ hoặc Bước khác. Tỷ lệ phần trăm là khối lượng chỉ khác là hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc trừ khi có quy định khác. Các phần và tỷ lệ phần trăm của hỗn hợp dung môi sắc ký được tính theo thể tích, trừ khi có quy định khác. Phổ  $^1\text{H}$  NMR được thông báo theo trường thấp ppm từ dung dịch tetrametylsilanin  $\text{CDCl}_3$  trừ khi có quy định khác; “s” nghĩa là vạch đơn, “d” nghĩa là vạch đôi. Phổ khối (*Mass spectra*: MS) được báo cáo dưới dạng phân tử lượng của ion gốc có nhiều đồng vị nhất ( $M+1$ ) được tạo ra bằng cách bổ sung  $\text{H}^+$  (phân tử lượng bằng 1) vào phân tử này, hoặc ( $M-1$ ) được tạo ra bằng cách làm mất  $\text{H}^+$  (phân tử lượng bằng 1) ra khỏi phân tử này, quan sát được bằng cách sử dụng lồng sắc ký được liên hợp với quang phổ khối (LCMS) bằng cách sử dụng phương pháp ion hóa bằng hóa học tại áp suất khí quyển ( $\text{AP}^+$ ), trong đó “amu” đại diện cho đơn vị khối lượng nguyên tử không xác định.

#### Ví dụ tổng hợp 1

Điều chế N-(2,3-diflophenyl)-4-[(4-flophenyl)metyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxamit  
(Hợp chất 13)

Bước A: Điều chế 1,3-dietyl 2-[2-(4-flophenyl)etyliden]propandioat

Titan tetraclorea (14,5ml, 14,5mmol, 1M trong metylen clorua) được thêm từng giọt vào 20ml tetrahydrofuran và được làm lạnh đến  $-1,5^\circ\text{C}$ . Nhiệt độ được duy trì dưới  $3,5^\circ\text{C}$  trong suốt thời gian thêm từng giọt. Hỗn dịch màu vàng tạo thành được kết hợp từ từ với dung dịch chứa 4-flophenyl axetaldehyt (4g, 29,0mmol) và dietyl malonat (4,6g, 29,0mmol) trong 25ml tetrahydrofuran khô trong khi vẫn duy trì nhiệt độ bên trong dưới  $3^\circ\text{C}$ . Tại thời điểm này, pyridin khô (9,2ml, 115,8mmol) được thêm vào dung dịch, tiếp theo dung dịch được khuấy trong 1 giờ. trong khi vẫn duy trì nhiệt độ bên trong là  $-3^\circ\text{C}$  đến  $0^\circ\text{C}$  và tiếp theo để hỗn hợp này ấm đến nhiệt độ môi trường trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng nước và được chiết bằng ete. Dịch chiết hữu cơ thu gom được rửa lần lượt bằng nước, dung dịch HCl 0,5N trong nước, nước, dung dịch  $\text{NaHCO}_3$  bão hòa trong nước và dung dịch NaCl bão hòa trong nước và cuối cùng làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ . Chất thô được sắc ký trên silicagel (60–120 mesh), rửa giải bằng 30% etyl axetat trong ete dầu mỏ để thu được 4,0g sản phẩm thô của hợp chất nêu ở đề mục này, chất này được đưa vào Bước B mà không cần mô tả đặc điểm hoặc tinh chế thêm.

Bước B: Điều chế 1,3-dietyl 2-[1-(4-flophenyl)metyl]-2-nitroetyl]propandioat

Nitrometan (8,7g, 142,7mmol), rồi đến natri etoxit (0,388g, 1,4mmol, 25 % trọng lượng trong etanol) được thêm vào dung dịch chứa 1,3-dietyl 2-[2-(4-

flophenyl)etylidene]propandioat (tức là sản phẩm của Bước A, 4g, 14,3mmol) trong ethanol (40ml) và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng ethyl axetat và được rửa bằng nước và dung dịch nước muối. Lớp hữu cơ được tách ra và làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô trong chân không. Chất thô được sắc ký trên silicagel (60–120 mesh), rửa giải bằng 30% ethyl axetat trong ete dầu mỏ để thu được 5,0g sản phẩm thô của hợp chất nêu ở đề mục này, chất này được đưa vào Bước C mà không cần mô tả đặc điểm hoặc tinh chế thêm.

Bước C: Điều chế ethyl 4-[(4-flophenyl)methyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxylat

$\text{NiAc}_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$  (18,2g, 73,2mmol) được thêm vào dung dịch chứa 1,3-diethyl 2-[1-(4-flophenyl)methyl]-2-nitroethyl]propandioat (tức là sản phẩm của Bước B, 5,0g, 14,7mmol) trong ethanol (50ml). Dung dịch được làm lạnh đến  $0^\circ\text{C}$  và  $\text{NaBH}_4$  (2,7g, 73,2mmol) được thêm vào từng giọt. Dung dịch được để ấm đến nhiệt độ môi trường và được khuấy trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng được lọc qua chất trợ lọc đất tảo Celite®. Dịch lọc được pha loãng bằng ethyl axetat và được rửa bằng nước và dung dịch nước muối. Lớp hữu cơ được tách ra và tiếp theo làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô trong chân không. Chất thô được sắc ký trên silicagel (60–120 mesh), rửa giải bằng 60% ethyl axetat trong ete dầu mỏ để thu được hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn (0,85g).

MS:  $[\text{M}+1]$  266,0,

Bước D: Điều chế axit 4-[(4-flophenyl)methyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxylic

Natri hydroxit (0,362g, dung dịch 50% trọng lượng trong nước) được thêm vào dung dịch chứa ethyl 4-[(4-flophenyl)methyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxylat (tức là sản phẩm của Bước C, 0,8g, 3,0mmol) trong ethanol (10ml) ở  $0^\circ\text{C}$ . Dung dịch phản ứng được khuấy và để ấm đến nhiệt độ môi trường trong 16 giờ. Khối phản ứng được pha loãng bằng ethyl axetat và được rửa bằng dung dịch HCl 1N trong nước, nước và dung dịch nước muối. Lớp hữu cơ được tách ra và tiếp theo làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô trong chân không. Chất thô được tinh chế bằng cách nghiền với diethyl ete và pentan để thu được hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn (0,5g).

MS:  $[\text{M}-1]$  236,0.

Bước E: Điều chế N-(2,3-diflophenyl)-4-[(4-flophenyl)methyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxamid

Triethylamin (0,255g, 2,5mmol) và 2,3-difloalanin (0,120g, 0,93mmol), rồi đến anhydrit propylphosphonic (0,456g, 1,4mmol) được thêm vào dung dịch chứa axit 4-[(4-flophenyl)methyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxylic (tức là sản phẩm của Bước D, 0,2g, 0,84mmol) trong metylen clorua (2ml). Dung dịch được khuấy trong 16 giờ và tiếp theo được pha loãng với ethyl axetat, và được rửa bằng nước và dung dịch nước muối. Lớp hữu cơ được tách ra và tiếp theo làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô trong chân không. Chất thô được tinh chế bằng cách nghiền với diethyl ete và pentan để thu được hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng nhờ (0,18g).

MS:  $[\text{M}-1]$  236,0 và MP  $173-176^\circ\text{C}$ ;

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ , 300MHz)  $\delta$  10,06 (s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,61–7,64 (m, 1H), 7,01–7,28 (m, 6H), 3,45–3,48 (m, 1H), 3,25–3,27 (m, 1H), 2,95–3,08 (m, 2H), 2,79–2,81 (m, 2H).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế *N*-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-4-[(1*E*)-2-phenyletenyl]-3-pyrolidincarboxamit (Hợp chất 33)

Bước A: Điều chế 1,3-dietyl 2-[(2*E*)-3-phenyl-2-propen-1-yliden]-propandioat

Axit axetic (0,43ml) được thêm vào dung dịch chứa (2*E*)-3-phenyl-2-propenal (5,0g, 37,83mmol), dietyl malonat (6,05g, 37,83mmol) và piperidin (0,64g, 7,57mmol) trong toluen (30ml). Hỗn hợp phản ứng được hồi lưu trong 3 giờ trong bình Dean-Stark để loại bỏ nước bằng cách cất đẳng phí. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn hợp phản ứng được rót vào nước (25ml) và được chiết bằng etyl axetat ( $3 \times 25\text{ml}$ ). Các lớp hữu cơ thu gom được rửa bằng nước (25ml), làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô để thu được sản phẩm thô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột trên silicagel, rửa giải bằng 0% đến 100% etyl axetat trong ete dầu mỏ, để thu được hợp chất nêu ở đề mục này (8,0g) dưới dạng dịch lỏng màu nâu nhạt.

$^1\text{H}$  NMR  $\delta$  7,54–7,48 (m, 3H), 7,39–7,34 (m, 3H), 7,29–7,23 (m, 1H), 7,04 (d,  $J = 15,2$  Hz, 1H), 4,37 (q,  $J = 6,8$  Hz, 2H), 4,28 (q,  $J = 6,8$  Hz, 2H), 1,40–1,28 (m, 6H).

Bước B: Điều chế 1,3-dietyl 2-[(2*E*)-1-(nitrometyl)-3-phenyl-2-propen-1-yl]propandioat

Natri metoxit (120 mg, 2,18mmol) được thêm vào dung dịch chứa 1,3-dietyl 2-[(2*E*)-3-phenyl-2-propen-1-yliden]-propandioat (tức là sản phẩm của Bước A, 6,0g, 21,87mmol) và nitrometan (2,0g, 32,80mmol) trong etanol (60ml) ở  $0^\circ\text{C}$ . Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở  $23^\circ\text{C}$  qua đêm. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn hợp phản ứng được cô dưới áp suất giảm, và khối sản phẩm phản ứng thô được chiết bằng etyl axetat ( $3 \times 40\text{ml}$ ). Lớp hữu cơ được rửa bằng nước (50ml), làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô để thu được sản phẩm thô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột, rửa giải bằng 0% đến 100% etyl axetat trong ete dầu mỏ, để thu được hợp chất nêu ở đề mục này (3,9g) dưới dạng chất rắn màu vàng nhạt.

$^1\text{H}$  NMR  $\delta$  7,33–7,24 (m, 5H), 6,57 (d,  $J = 16,0$  Hz, 1H), 6,15–6,08 (m, 1H), 4,77–4,66 (m, 2H), 4,25–4,16 (m, 4H), 3,75–3,72 (m, 1H), 3,66 (d,  $J = 7,2$  Hz, 1H), 1,29–1,20 (m, 6H).

Bước C: Điều chế etyl 2-oxo-4-[(1*E*)-2-phenyletenyl]-3-pyrolidincarboxylat

Hỗn hợp chứa 1,3-dietyl 2-[(2*E*)-1-(nitrometyl)-3-phenyl-2-propen-1-yl]propandioat (tức là sản phẩm của Bước B, 3,9g, 11,62mmol), bột sắt (3,25g, 58,15mmol) và amoni clorua (310 mg, 5,81mmol) trong hỗn hợp chứa etanol và nước (9:1, 60ml) được đun nóng đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trong 24 giờ. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn

hợp phản ứng được lọc, và dịch lọc được cô dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột trên silicagel, rửa giải bằng 0% đến 100% etyl axetat trong ete dầu mỏ, để thu được hợp chất nêu ở đề mục này (1,5g) dưới dạng chất lỏng màu vàng nhạt.

$^1\text{H}$  NMR  $\delta$  7,36–7,23 (m, 5H), 6,54 (d,  $J = 15,6$  Hz, 1H), 6,18–6,12 (m, 1H), 5,94 (brs, 1H), 4,26 (q,  $J = 6,8$  Hz, 2H), 3,73–3,63 (m, 2H), 3,32 (d,  $J = 8,8$  Hz, 1H), 3,25 (t,  $J = 8,4$  Hz, 1H), 1,31 (t,  $J = 6,8$  Hz, 3H).

Bước D: Điều chế *N*-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-4-[(1*E*)-2-phenyletenyl]-3-pyrolidincarboxamit

Dung dịch natri hydroxit 1N trong nước được thêm vào dung dịch chứa 2-oxo-4-[(1*E*)-2-phenyletenyl]-3-pyrolidincarboxylat (tức là sản phẩm của Bước C, 1,5g, 5,78mmol) trong hỗn hợp chứa metanol và tetrahydrofuran (6:4, 20ml). Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 23°C trong 16 giờ. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 0°C, được axit hóa bằng dung dịch axit clohydric 1N và được chiết bằng etyl axetat (3  $\times$  25ml). Lớp hữu cơ được rửa bằng nước (20ml), làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô để thu được axit trung gian (1,12g), chất này được sử dụng trực tiếp trong bước kết hợp amin mà không cần tinh chế thêm. Anhydrit propylphosphonic (T3P®) (1,24g, 3,89mmol) được thêm vào dung dịch chứa axit trung gian (0,6g, 2,59mmol), 2,3-difloaniline (0,4g, 3,11mmol) và triethylamin (1,09ml, 7,78mmol) trong metylen clorua (20ml) ở 0°C. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 23°C qua đêm. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn hợp phản ứng được rót vào nước (15ml) và được chiết bằng diclometan (3  $\times$  15ml). Lớp hữu cơ được tách ra, làm khô trên  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  và được cô dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô. Hợp chất thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột, rửa giải bằng 0% đến 100% etyl axetat trong ete dầu mỏ, để thu được hợp chất nêu ở đề mục này, hợp chất theo sáng chế, dưới dạng chất rắn màu trắng nhờ (0,5g).

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10,23 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,80–7,76 (m, 1H), 7,41 (d,  $J = 7,6$  Hz, 2H), 7,32 (t,  $J = 7,6$  Hz, 2H), 7,24–7,15 (m, 3H), 6,52 (d,  $J = 16$  Hz, 1H), 6,40–6,34 (m, 1H), 3,67 (d,  $J = 9,6$  Hz, 1H), 3,60–3,56 (m, 1H), 3,49 (t,  $J = 8,8$  Hz, 1H), 3,17 (t,  $J = 8,8$  Hz, 1H).

Ví dụ tổng hợp 3

Điều chế *N*-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-4-(2-phenyletyl)-3-pyrolidincarboxamit (Hợp chất 35)

Bước A: Điều chế *N*-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-4-(2-phenyletyl)pyrrolidin-3-carboxamit

Dung dịch chứa *N*-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-4-[(1*E*)-2-phenyletenyl]-3-pyrrolidincarboxamit (tức là sản phẩm của Ví dụ 2, Bước D, 0,30g, 0,87mmol) trong etanol (20ml) được đưa vào môi trường nitor. Paladi trên cacbon (10%, 0,150g) được thêm vào, và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong điều kiện áp suất quả cầu hydro ở 23°C trong 2 giờ. Tiến trình phản ứng được theo dõi bằng phép phân tích sắc ký lớp mỏng. Sau khi hoàn thành, hỗn hợp phản ứng được lọc qua chất trợ lọc đất tảo Celite®, và dịch lọc được cô dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm thô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột trên silicagel, rửa giải bằng 0% đến 100% etyl axetat trong ete dầu mỏ, để thu được hợp chất nêu ở đề mục này, hợp chất theo sáng chế, dưới dạng chất rắn không màu (0,20g).

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10,24 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,79–7,76 (m, 1H), 7,29–7,16 (m, 7H), 3,46–3,39 (m, 2H), 2,94 (t, *J* = 8,8 Hz, 1H), 2,77–2,71 (m, 1H), 2,59 (t, *J* = 8,0 Hz, 2H), 1,86–1,74 (m, 2H).

Ví dụ tổng hợp 4

Điều chế 4-[2-(3-clophenyl)etynyl]N-(2-flophenyl)-2-oxo-3-pyrrolidincarboxamit (Hợp chất 25)

Bước A: Điều chế 3-(3-clophenyl)-2-propynal

Bước B: Điều chế 1,3-dietyl 2-[3-(3-clophenyl)-2-propyn-1-yliden]propandioat

Bước C: Điều chế 1,3-dietyl 2-[3-(3-clophenyl)-1-(nitrometyl)-2-propyn-1-yl]propandioat

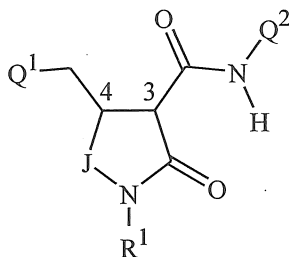
Bước D: Điều chế etyl 4-[2-(3-clophenyl)etynyl]-2-oxo-3-pyrrolidincarboxylat

Bước E: Điều chế 4-[2-(3-clophenyl)etynyl]-2-oxo-3-pyrrolidincarboxylic acid

Bước F: Điều chế 4-[2-(3-clophenyl)etynyl]-N-(2-flophenyl)-2-oxo-3-pyrrolidincarboxamit

Bảng các quy trình được mô tả ở đây cùng với các phương pháp đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này, có thể điều chế được các hợp chất của các Bảng 1 đến 320 sau. Các từ viết tắt sau được sử dụng trong các Bảng là như sau: *t* nghĩa là bậc ba, *s* nghĩa là bậc hai, *n* nghĩa là thường, *i* nghĩa là iso, *c* nghĩa là xyclo, Me nghĩa là metyl, Et nghĩa là etyl, Pr nghĩa là propyl, Bu nghĩa là butyl, *i*-Pr nghĩa là isopropyl, *c*-Pr xyclopropyl, *t*-Bu nghĩa là butyl bậc ba, *c*-Bu nghĩa là xyclobutyl, Ph nghĩa là phenyl, OMe nghĩa là metoxy, OEt nghĩa là etoxy, SMe nghĩa là methylthio, NHMe nghĩa là metylamino, CN nghĩa là xyano, NO<sub>2</sub> nghĩa là nitro, TMS nghĩa là trimetylsilyl, SMe nghĩa là metylsulfinyl, C<sub>2</sub>F<sub>5</sub> nghĩa là CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> và SO<sub>2</sub>Me nghĩa là metylsulfonyl.

Bảng 1



J = -CH<sub>2</sub>-; R<sup>1</sup> = H; Q<sup>2</sup> = Ph(2-F); và Q<sup>1</sup> =

| Q <sup>1</sup>                           | Q <sup>1</sup>                  | Q <sup>1</sup>                               |
|------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------------------|
| Ph(3-Cl)                                 | Ph(3-Me,4-F)                    | 4-Pyridinyl(3-Me)                            |
| Ph(3-F)                                  | Ph(3-F,4-Me)                    | 4-Pyridinyl(2-F)                             |
| Ph(3-Br)                                 | Ph(3-CF <sub>3</sub> ,4-F)      | 4-Pyridinyl(2-CF <sub>3</sub> )              |
| Ph(3-Me)                                 | Ph(3-F,4-CF <sub>3</sub> )      | 4-Pyridinyl(2-Me)                            |
| Ph(3-Et)                                 | Ph(2,3,4-tri-F)                 | 2-Thienyl                                    |
| Ph(3-CF <sub>3</sub> )                   | Ph(3,4,5-tri-F)                 | 2-Thienyl(4-CF <sub>3</sub> )                |
| Ph(3-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 2-Pyridinyl                     | 2-Thienyl(5-CF <sub>3</sub> )                |
| Ph(3-OCF <sub>3</sub> )                  | 2-Pyridinyl(6-F)                | 3-Thienyl                                    |
| Ph(3-OCF <sub>2</sub> H)                 | 2-Pyridinyl(6-CF <sub>3</sub> ) | 3-Thienyl(4-CF <sub>3</sub> )                |
| Ph(3-O- <i>i</i> -Pr)                    | 2-Pyridinyl(6-Me)               | 3-Thienyl(5-CF <sub>3</sub> )                |
| Ph(3-OMe)                                | 2-Pyridinyl(5-F)                | 2-Furyl                                      |
| Ph(3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H) | 2-Pyridinyl(5-CF <sub>3</sub> ) | 2-Furyl(4-CF <sub>3</sub> )                  |
| Ph(2-Cl)                                 | 2-Pyridinyl(5-Me)               | 2-Furyl(5-CF <sub>3</sub> )                  |
| Ph(2-F)                                  | 2-Pyridinyl(4-F)                | 3-Furyl                                      |
| Ph(2-Br)                                 | 2-Pyridinyl(4-CF <sub>3</sub> ) | 3-Furyl(4-CF <sub>3</sub> )                  |
| Ph(2-Me)                                 | 2-Pyridinyl(4-Me)               | 3-Furyl(5-CF <sub>3</sub> )                  |
| Ph(2-CF <sub>3</sub> )                   | 2-Pyridinyl(3-F)                | 1 <i>H</i> -Pyrazol-1-yl                     |
| Ph(2-OCF <sub>3</sub> )                  | 2-Pyridinyl(3-CF <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -Pyrazol-1-yl  |
| Ph(2-OCF <sub>2</sub> H)                 | 2-Pyridinyl(3-Me)               | 1 <i>H</i> -Imidazol-1-yl                    |
| Ph(2-OMe)                                | 3-Pyridinyl                     | 4-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -Imidazol-1-yl |
| Ph(2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H) | 3-Pyridinyl(6-F)                | 2-CF <sub>3</sub> -1 <i>H</i> -Imidazol-1-yl |
| Ph(2-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 3-Pyridinyl(6-CF <sub>3</sub> ) | 1-Me-1 <i>H</i> -Imidazol-2-yl               |
| Ph(2-O- <i>i</i> -Pr)                    | 3-Pyridinyl(6-Me)               | 1-Me-1 <i>H</i> -Imidazol-4-yl               |
| Ph(4-Cl)                                 | 3-Pyridinyl(5-F)                | 3-Me-1 <i>H</i> -Imidazol-4-yl               |
| Ph(4-F)                                  | 3-Pyridinyl(5-CF <sub>3</sub> ) | 1-Me-1 <i>H</i> -Pyrazol-4-yl                |
| Ph(4-Br)                                 | 3-Pyridinyl(5-Me)               | 1-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-Triazol-4-yl          |
| Ph(4-Me)                                 | 3-Pyridinyl(4-F)                | 2-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-Triazol-4-yl          |
| Ph(4-Et)                                 | 3-Pyridinyl(4-CF <sub>3</sub> ) | 4-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-Triazol-2-yl          |
| Ph(4-CF <sub>3</sub> )                   | 3-Pyridinyl(4-Me)               | 4-Me-1 <i>H</i> -1,2,3-Triazol-1-yl          |
| Ph(4-OCF <sub>3</sub> )                  | 3-Pyridinyl(2-F)                | Pyrazin-2-yl                                 |
| Ph(4-OCF <sub>2</sub> H)                 | 3-Pyridinyl(2-CF <sub>3</sub> ) | Pyrazin-2-yl(5-CF <sub>3</sub> )             |
| Ph(4-OMe)                                | 3-Pyridinyl(2-Me)               | Pyrimidin-2-yl                               |
| Ph(4-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-Pyridinyl                     | Pyrimidin-2-yl(5-CF <sub>3</sub> )           |
| Ph(4-O- <i>i</i> -Pr)                    | 4-Pyridinyl(6-F)                | Pyrimidin-5-yl                               |
| Ph(4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H) | 4-Pyridinyl(6-CF <sub>3</sub> ) | Pyrimidin-5-yl(2-CF <sub>3</sub> )           |
| Ph(2,3-di-F)                             | 4-Pyridinyl(6-Me)               | 1,3,5-Triazin-2-yl                           |
| Ph(2,4-di-F)                             | 4-Pyridinyl(5-F)                | Thiazol-2-yl                                 |
| Ph(2,5-di-F)                             | 4-Pyridinyl(5-CF <sub>3</sub> ) | Thiazol-2-yl(5-CF <sub>3</sub> )             |
| Ph(2,6-di-F)                             | 4-Pyridinyl(5-Me)               | Thiazol-5-yl                                 |
| Ph(3,4-di-F)                             | 4-Pyridinyl(3-F)                | Thiazol-5-yl(2-CF <sub>3</sub> )             |
| Ph(3,5-di-F)                             | 4-Pyridinyl(3-CF <sub>3</sub> ) |                                              |

| Q <sup>1</sup>                         | Q <sup>1</sup>                                                         | Q <sup>1</sup>                                                          |
|----------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------|
| Oxazol-2-yl                            | 1,4-Dioxolan-2-yl                                                      | Ph(3-SCF <sub>3</sub> )                                                 |
| Oxazol-2-yl(5-CF <sub>3</sub> )        | 1,4-Dithiolan-2-yl                                                     | Ph(3-S- <i>c</i> -Pr)                                                   |
| Oxazol-5-yl                            | 1-naphtyl                                                              | Ph(3-SOMe)                                                              |
| Oxazol-5-yl(2-CF <sub>3</sub> )        | 2-naphtyl                                                              | Ph(3-SOCF <sub>3</sub> )                                                |
| Isothiazol-5-yl                        | Benzofuran-2-yl                                                        | Ph(3-SO- <i>c</i> -Pr)                                                  |
| Isothiazol-5-yl(3-CF <sub>3</sub> )    | Benzothiophen-2-yl                                                     | Ph(3-SO <sub>2</sub> Me)                                                |
| Isothiazol-3-yl                        | 1,3-Benzoxazol-2-yl                                                    | Ph(3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                                  |
| Isothiazol-3-yl(5-CF <sub>3</sub> )    | 1,3-Benzothiazol-2-yl                                                  | Ph(3-SO <sub>2</sub> - <i>c</i> -Pr)                                    |
| Isoxazol-5-yl                          | 7-Quinoliny                                                            | Ph(3-propargyl)                                                         |
| Isoxazol-5-yl(3-CF <sub>3</sub> )      | Indazol-1-yl                                                           | Ph(3-(2-Butynyl))                                                       |
| Isoxazol-3-yl                          | Benzimidazol-1-yl                                                      | Ph(2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) |
| Isoxazol-3-yl(5-CF <sub>3</sub> )      | Indol-1-yl                                                             | Ph(2-CF <sub>3</sub> )                                                  |
| 1 <i>H</i> -1,2,3,4-Tetrazol-1-yl      | Pyrolo[2,3- <i>c</i> ]pyridin-1-yl                                     | Ph(3-CF <sub>3</sub> )                                                  |
| 5-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-Tetrazol-1-yl | Ph(3-OCH <sub>2</sub> - <i>c</i> -Pr)                                  | Ph(2-C(=O)CH <sub>3</sub> )                                             |
| 1-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-Tetrazol-5-yl | Ph(2-OCH <sub>2</sub> - <i>c</i> -Pr)                                  | Ph(2-OC(=O)CH <sub>3</sub> )                                            |
| 1 <i>H</i> -1,2,4-Triazol-1-yl         | Ph(4-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - <i>c</i> -hex)                 | Ph(3-OC(=O)CH <sub>3</sub> )                                            |
| 1,3,4-Oxadiazol-2-yl                   | Ph(CH <sub>2</sub> - <i>c</i> -Pr)                                     | Ph(2-OC(=O)CF <sub>3</sub> )                                            |
| 1,3,4-Thiadiazol-2-yl                  | Ph(4-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - <i>c</i> -hex)                  | Ph(3-OC(=O)CF <sub>3</sub> )                                            |
| 1,2,4-Oxadiazol-3-yl                   | Ph(3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> )                                |                                                                         |
| 1,2,4-Thiadiazol-3-yl                  | Ph(2-(3,3-dicloallyloxy))                                              |                                                                         |
| Tetrahydropyran-2-yl                   | Ph(2-metoxetoxo)                                                       |                                                                         |
| Tetrahydropyran-3-yl                   | Ph(3-propoxypropoxy)                                                   |                                                                         |
| Tetrahydrofuran-2-yl                   | Ph(2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> )                |                                                                         |
| Tetrahydrofuran-3-yl                   | Ph(2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub> )               |                                                                         |
| 1,3-Dioxolan-4-yl                      | Ph(2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) |                                                                         |
| 2,2-di-F-1,3-Dioxolan-4-yl             | Ph(3-SMe)                                                              |                                                                         |
| 1,3-Dithiolan-4-yl                     |                                                                        |                                                                         |

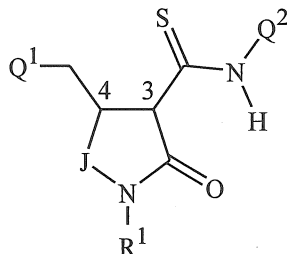
Bảng 2 được cấu trúc theo cách tương tự như vậy chỉ khác là Đề mục của hàng “J = -CH<sub>2</sub>-; R<sup>1</sup> = H; Q<sup>2</sup> = Ph(2-F); và Q<sup>1</sup> = ” được thay thế bằng Đề mục của hàng được nêu cho Bảng 2 dưới đây (tức là “J = -CH<sub>2</sub>-; R<sup>1</sup> = H; Q<sup>2</sup> = Ph(2,3-di-F); và Q<sup>1</sup> = ”). Vì vậy, mục thứ nhất trong Bảng 2 là hợp chất có công thức 1 trong đó J là -CH<sub>2</sub>-; R<sup>1</sup> là H; Q<sup>2</sup> là Ph(2,3-di-F); và Q<sup>1</sup> là Ph(3-Cl) (tức là 3-clophenyl). Các Bảng từ 3 đến 40 được cấu trúc theo cách tương tự.

| Bảng | Đề mục của hàng                                                                                            |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 2    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2,3-di-F); và Q <sup>1</sup> =             |
| 3    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2,4-di-F); và Q <sup>1</sup> =             |
| 4    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2,3,4-tri-F); và Q <sup>1</sup> =          |
| 5    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2-CF <sub>3</sub> ); và Q <sup>1</sup> =   |
| 6    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2-Me); và Q <sup>1</sup> =                 |
| 7    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2-NO <sub>2</sub> ); và Q <sup>1</sup> =   |
| 8    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2-Cl); và Q <sup>1</sup> =                 |
| 9    | J = -CH <sub>2</sub> -; R <sup>1</sup> = H; Q <sup>2</sup> = Ph(2-SO <sub>2</sub> Me); và Q <sup>1</sup> = |

|    |                                                                      |
|----|----------------------------------------------------------------------|
| 10 | $J = -CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-F,3-Cl); \text{ và } Q^1 =$         |
| 11 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-F); \text{ và } Q^1 =$          |
| 12 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2,3-di-F); \text{ và } Q^1 =$     |
| 13 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2,4-di-F); \text{ và } Q^1 =$     |
| 14 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2,3,4-tri-F); \text{ và } Q^1 =$  |
| 15 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-CF_3); \text{ và } Q^1 =$       |
| 16 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-Me); \text{ và } Q^1 =$         |
| 17 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-NO_2); \text{ và } Q^1 =$       |
| 18 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-Cl); \text{ và } Q^1 =$         |
| 19 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-SO_2Me); \text{ và } Q^1 =$     |
| 20 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = H; Q^2 = Ph(2-F,3-Cl); \text{ và } Q^1 =$     |
| 21 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-F); \text{ và } Q^1 =$             |
| 22 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,3-di-F); \text{ và } Q^1 =$        |
| 23 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,4-di-F); \text{ và } Q^1 =$        |
| 24 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,3,4-tri-F); \text{ và } Q^1 =$     |
| 25 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-CF_3); \text{ và } Q^1 =$          |
| 26 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-Me); \text{ và } Q^1 =$            |
| 27 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-NO_2); \text{ và } Q^1 =$          |
| 28 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-Cl); \text{ và } Q^1 =$            |
| 29 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-SO_2Me); \text{ và } Q^1 =$        |
| 30 | $J = -CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-F,3-Cl); \text{ và } Q^1 =$        |
| 31 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-F); \text{ và } Q^1 =$         |
| 32 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,3-di-F); \text{ và } Q^1 =$    |
| 33 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,4-di-F); \text{ và } Q^1 =$    |
| 34 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2,3,4-tri-F); \text{ và } Q^1 =$ |
| 35 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-CF_3); \text{ và } Q^1 =$      |
| 36 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-Me); \text{ và } Q^1 =$        |
| 37 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-NO_2); \text{ và } Q^1 =$      |
| 38 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-Cl); \text{ và } Q^1 =$        |
| 39 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-SO_2Me); \text{ và } Q^1 =$    |
| 40 | $J = -CH_2CH_2-; R^1 = Me; Q^2 = Ph(2-F,3-Cl); \text{ và } Q^1 =$    |

Bảng 41

Bảng 41 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

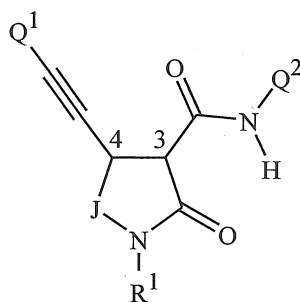


Bảng 42 đến 80

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 42 đến 80, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc in Bảng 41 ở trên.

Bảng 81

Bảng 81 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

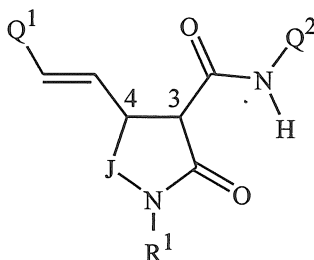


Bảng 82 đến 120

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 82 đến 120, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc in Bảng 81 ở trên.

Bảng 121

Bảng 121 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

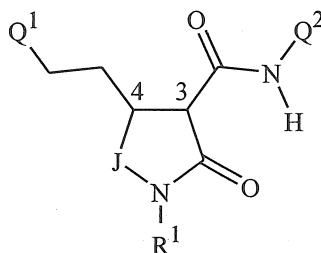


## Bảng 122 đến 160

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 122 đến 160, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc in Bảng 121 ở trên.

## Bảng 161

Bảng 161 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

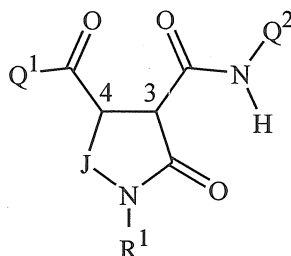


## Bảng 162 đến 200

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 162 đến 200, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc trong Bảng 161 ở trên.

## Bảng 201

Bảng 201 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

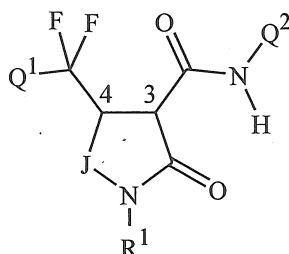


## Bảng 202 đến 240

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 202 đến 240, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc trong Bảng 201 ở trên.

Bảng 241

Bảng 241 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:

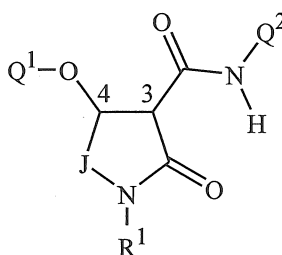


Bảng 242 đến 280

Phần mô tả này còn bao gồm Bảng 242 đến 280, mỗi Bảng được xây dựng theo cách giống như Bảng 2 đến 40 ở trên, chỉ khác là thay công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc trong Bảng 241 ở trên.

Bảng 281

Bảng 281 được xây dựng theo cách tương tự như Bảng 1 ở trên, chỉ khác là công thức cấu trúc được thay thế bằng công thức cấu trúc sau:



Bảng 282 đến 320

Hợp chất theo sáng chế cũng bao gồm các hợp chất trung gian được nêu trong các Bảng từ 282 đến 320, mỗi Bảng này được cấu trúc theo cách giống như các Bảng từ 2 đến 40 nêu trên, chỉ khác là cấu trúc này được thay thế bằng cấu trúc trong Bảng 281 nêu trên.

#### Chế phẩm/Tính hữu ích

Hợp chất theo sáng chế thường được sử dụng làm hoạt chất diệt cỏ trong chế phẩm, tức là thành phần, với ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, dùng làm chất mang. Các thành phần của chế phẩm hoặc hỗn hợp được chọn phù hợp với các tính chất lý học của hoạt chất, kiểu dùng và các yếu tố môi trường như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Dạng pha chế hữu ích bao gồm cả chế phẩm dạng lỏng và chế phẩm dạng rắn. Chế phẩm dạng lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa), huyền

phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Chế phẩm dạng lỏng chứa nước thường là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, chất cô đặc dễ chảy và nhũ tương-huyền phù. Chế phẩm dạng lỏng không chứa nước thường là dạng cô đặc dễ nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

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

Chế phẩm dạng phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn như vậy được pha chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước, nhưng đôi khi là môi trường thích hợp khác như hydrocarbon thơm hoặc parafin hoặc dầu thực vật. Lượng dung dịch để phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thường là nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng.

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

| Phân trăm khối lượng                                                                    |                  |                       |                              |
|-----------------------------------------------------------------------------------------|------------------|-----------------------|------------------------------|
|                                                                                         | <u>Hoạt chất</u> | <u>Chất pha loãng</u> | <u>Chất hoạt động bề mặt</u> |
| Hạt, viên nén và bột dễ hòa tan trong nước và dễ phân tán trong nước                    | 0,001–90         | 0–99,999              | 0–15                         |
| Thế phân tán dạng dầu, huyền phù, nhũ tương, dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa) | 1–50             | 40–99                 | 0–50                         |
| Bột mịn để rắc khô                                                                      | 1–25             | 70–99                 | 0–5                          |
| Hạt và viên tròn                                                                        | 0,001–99         | 5–99,999              | 0–15                         |
| Chế phẩm đậm đặc                                                                        | 90–99            | 0–10                  | 0–2                          |

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

Chất pha loãng dạng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-dimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-dimetylformamit), limonen, dimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyroliton (ví dụ, *N*-metylpyrolitinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen carbonat, butylen carbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, hydrocacbon thơm, chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như este lactat alkylat hóa, este dibazo và  $\gamma$ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-etylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, rượu diaxeton và rượu benzylic. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là có 6 đến 22 nguyên tử cacbon), như dầu

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

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

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại thành dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu dụng đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: rượu alkoxylat như rượu alkoxylat trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit được etoxylat hóa; triglyxerit được alkoxylat hóa như đậu tương được etoxylat hóa, dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, đinonyl phenol etoxylat và dodexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); polyme khối được điều chế từ etylen-oxit hoặc propylen-oxit và các polyme khối nghịch, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen-oxit; các axit béo etoxylat hóa; các este béo và các dầu được etoxylat hóa; các metyl este được etoxylat hóa; tristyrilphenol được etoxylat hóa (bao gồm các dạng được điều chế từ etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este của axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất nền mỡ lỏng cừ, các este polyetoxylat như các este sorbitan axit béo được polyetoxy hoá, các este sorbitol axit béo được polyetoxy hoá và các este glyxerol axit béo được polyetoxy hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyt (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt nền silic; và dẫn xuất của đường như este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysaccarit.

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

Chất hoạt động bề mặt cation hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các amit và các amit được etoxylat hóa; các amin như *N*-alkyl propandiamin, tripropylentriamin và dipropylentetramin, và các amin được etoxylat hóa, các điamin được etoxylat hóa và các amin được propoxylat hóa (được điều chế từ các amin và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các muối amin như amin axetat và các muối điamin; các muối amoni bậc bốn như muối bậc bốn, các muối bậc bốn và các muối được tạo bậc bốn hai lần được etoxylat hóa; và amin-oxit như alkyl dimetylamin-oxit và bis-(2-hydroxyetyl)-alkylamin-oxit.

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

Chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa hỗn hợp chất bổ trợ và chất phụ gia, là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực dưới dạng chất trợ điều chế (một số chất trong số các chất này có thể được xem là hoạt động chức năng như chất pha loãng dạng rắn, chất pha loãng dạng lỏng và chất hoạt động bề mặt). Chất bổ trợ và chất phụ gia như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (dung dịch đệm), hiện tượng tạo bọt trong quá trình xử lý (chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), hiện

tượng lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong đồ chứa (chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (chất chống đông), màu sắc (chất phân tán tạo màu/chất nhuộm), hiện tượng rửa trôi (chất tạo màng hoặc chất dính), sự bay hơi (chất làm chậm bay hơi), và các hiện tượng khác tương tự. Chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrroliton-vinyl axetat, rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và sáp. Ví dụ về chất bổ trợ và chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm chất được liệt kê trong *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và Bắc Mỹ do McCutcheon's Division xuất bản, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; và Công bố đơn PCT số WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được đưa vào các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng dạng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc dễ nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2,000  $\mu\text{m}$  có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới 3  $\mu\text{m}$ . Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem, U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để thu được hạt phân tán trong nước. Chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10  $\mu\text{m}$ . Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem, Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và sau đó, và WO 91/13546. Dạng viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các phương pháp điều chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture” in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Cũng xem trong U.S. 3,235,361, cột 6, dòng 16 đến cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, dòng 43 đến cột 7, dòng 62 và các Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến cột 5, dòng 17 và các Ví dụ 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, trang 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

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

#### Ví dụ A

Chất cô đặc có nồng độ cao

|                                      |       |
|--------------------------------------|-------|
| Hợp chất 17                          | 98,5% |
| silic oxit aerogel                   | 0,5%  |
| silic oxit mịn vô định hình tổng hợp | 1,0%  |

#### Ví dụ B

Bột thấm ướt

|                                     |       |
|-------------------------------------|-------|
| Hợp chất 791                        | 65,0% |
| dodexylphenol polyetylen glycol ete | 2,0%  |
| natri ligninsulfonat                | 4,0%  |
| natri silicoaluminat                | 6,0%  |
| monmorilonit (nung)                 | 23,0% |

#### Ví dụ C

Dạng hạt

|              |       |
|--------------|-------|
| Hợp chất 801 | 10,0% |
|--------------|-------|

|                                                                                 |       |
|---------------------------------------------------------------------------------|-------|
| hạt atapulgít (chất bay hơi thấp 0,71/0,30mm;<br>hạt đi qua rây Mỹ cỡ số 25–50) | 90,0% |
|---------------------------------------------------------------------------------|-------|

## Ví dụ D

|                              |       |
|------------------------------|-------|
| Viên ép đùn                  |       |
| Hợp chất 51                  | 25,0% |
| natri sulfat khan            | 10,0% |
| canxi ligninsulfonat thô     | 5,0%  |
| natri alkylnaphtalensulfonat | 1,0%  |
| canxi/magie bentonit         | 59,0% |

## Ví dụ E

|                                 |       |
|---------------------------------|-------|
| Chất cô đặc dễ nhũ hóa          |       |
| Hợp chất 17                     | 10,0% |
| polyoxyetylen sorbitol hexoleat | 20,0% |
| este của axit béo C6–C10 metyl  | 70,0% |

## Ví dụ F

|                                          |       |
|------------------------------------------|-------|
| Vi nhũ tương                             |       |
| Hợp chất 791                             | 5,0%  |
| polyvinylpyroliton-vinyl axetat copolyme | 30,0% |
| Alkylpolyglycosit                        | 30,0% |
| glyxeryl monooleat                       | 15,0% |
| nước                                     | 20,0% |

## Ví dụ G

|                                                |       |
|------------------------------------------------|-------|
| Huyền phù đặc                                  |       |
| Hợp chất 801                                   | 35%   |
| copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen | 4,0%  |
| copolyme axit stearic/polyetylen glycol        | 1,0%  |
| polyme styren acrylic                          | 1,0%  |
| gôm xanthan                                    | 0,1%  |
| propylen glycol                                | 5,0%  |
| chất khử bọt nền silic                         | 0,1%  |
| 1,2-benzisothiazolin-3-on                      | 0,1%  |
| nước                                           | 53,7% |

## Ví dụ H

|                      |       |
|----------------------|-------|
| Nhũ tương trong nước |       |
| Hợp chất 51          | 10,0% |

|                                                |       |
|------------------------------------------------|-------|
| copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen | 4,0%  |
| copolyme axit stearic/polyetylen glycol        | 1,0%  |
| polyme styren acrylic                          | 1,0%  |
| gôm xanthan                                    | 0,1%  |
| propylen glycol                                | 5,0%  |
| chất khử bọt nền silic                         | 0,1%  |
| 1,2-benzisothiazolin-3-on                      | 0,1%  |
| hydrocacbon nền dầu mỏ thơm                    | 20,0  |
| nước                                           | 58,7% |

## Ví dụ I

|                                            |       |
|--------------------------------------------|-------|
| Chất phân tán dạng dầu                     |       |
| Hợp chất 17                                | 25%   |
| polyoxyetylen sorbitol hexaoleat           | 15%   |
| Đất sét bentonit được cải biến bằng hữu cơ | 2,5%  |
| metyl este của axit béo                    | 57,5% |

Sáng chế cũng bao gồm các ví dụ điều chế A đến I nêu trên chỉ khác là “Hợp chất 1” trong từng ví dụ trong số các ví dụ từ A đến I được thay thế bằng “Hợp chất 2”, “Hợp chất 3”, “Hợp chất 4”, “Hợp chất 5”, “Hợp chất 7”, “Hợp chất 8”, “Hợp chất 9”, “Hợp chất 10”, “Hợp chất 11”, “Hợp chất 12”, “Hợp chất 13”, “Hợp chất 14”, “Hợp chất 15”, “Hợp chất 16”, “Hợp chất 17”, “Hợp chất 18”, “Hợp chất 19”, “Hợp chất 20”, “Hợp chất 21”, “Hợp chất 22”, “Hợp chất 23”, “Hợp chất 24”, “Hợp chất 25”, “Hợp chất 26”, “Hợp chất 27”, “Hợp chất 28”, “Hợp chất 29”, “Hợp chất 30”, “Hợp chất 31”, “Hợp chất 32”, “Hợp chất 33” “Hợp chất 34” hoặc “Hợp chất 35”.

Kết quả thử nghiệm chỉ ra rằng hợp chất theo sáng chế là các thuốc diệt cỏ và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật trước nảy mầm và/hoặc sau nảy mầm có hoạt tính cao. Hợp chất theo sáng chế thường có cao nhất hoạt tính đối với việc phòng trừ cỏ dại ở giai đoạn sớm sau nảy mầm (tức là phun ngay sau khi hạt giống cỏ dại nảy mầm từ đất) và phòng trừ cỏ dại ở giai đoạn sau nảy mầm (tức là phun trước khi hạt giống cỏ dại nảy mầm từ đất). Nhiều hợp chất trong số chúng có tính hữu dụng cho việc phòng trừ cỏ dại phổ rộng trước và/hoặc sau nảy mầm ở những khu vực trong đó mong muốn phòng trừ hoàn toàn tất cả các loại thực vật như quanh thùng cất giữ nhiên liệu, khu vực cất giữ công nghiệp, nơi đỗ xe, khu vực dạy lái xe, sân bay, bờ sông, các đường tưới và tiêu khác, quanh bảng quảng cáo và cấu trúc đường quốc lộ và đường sắt. Nhiều hợp chất bất kỳ trong số các hợp chất theo sáng chế, nhờ trao đổi chất một cách chọn lọc ở cây trồng và cỏ dại, hoặc bằng cách chọn

lọc hoạt tính ở vị trí ức chế về mặt sinh lý ở cây trồng và cỏ dại, hoặc bằng cách thay thế một cách chọn lọc trên hoặc trong môi trường gồm hỗn hợp cây trồng và cỏ dại, là hữu ích để phòng trừ một cách chọn lọc cỏ và cỏ dại lá rộng trong hỗn hợp cây trồng/cỏ dại. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ hiểu rằng tổ hợp các yếu tố chọn lọc được ưu tiên này trong hợp chất hoặc nhóm hợp chất có thể được xác định một cách dễ dàng bằng cách thực hiện các thử nghiệm sinh học và/hoặc sinh hóa thông thường. Hợp chất theo sáng chế có thể có tính chống chịu các cây trồng nông nghiệp quan trọng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, cỏ linh lăng, lúa mạch, bông, lúa mì, cây cải dầu, cây củ cải đường, ngũ cốc (ngô), lúa miến, đậu tương, lúa, yến mạch, lạc, cây rau, cà chua, khoai tây, cây trồng đồn điền lâu năm bao gồm cà phê, ca cao, cọ, cao su, mía, cam quýt, nho, cây ăn quả, cây lấy hạt, chuối, mã đề, dừa, cây hoa bia, chè và rừng như bạch đàn và cây có quả hình nón (ví dụ, thông), và các loài trên lớp đất mặt (ví dụ, cỏ Kentucky, cỏ St. Augustine, cỏ đuôi trâu Kentucky và cỏ Bermuda). Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng ở cây trồng được biến nạp bằng di truyền hoặc được gây giống để kết hợp tính kháng thuốc diệt cỏ, có các protein độc với các vật gây hại không xương sống (như độc tố *Bacillus thuringiensis*), và/hoặc có các tính trạng hữu ích khác. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này cần hiểu rằng không phải tất cả các hợp chất đều có tác dụng chống lại tất cả các loại cỏ dại như nhau. Theo cách khác, hợp chất theo sáng chế hữu ích để cải biến sự sinh trưởng của thực vật.

Do hợp chất theo sáng chế có hoạt tính (diệt cỏ cả ở giai đoạn trước nảy mầm lẫn ở giai đoạn sau nảy mầm), để phòng trừ thực vật không mong muốn bằng cách diệt hoặc gây tổn thương thực vật hoặc làm giảm sự sinh trưởng của nó, hợp chất theo sáng chế có thể được phun hữu ích bằng nhiều phương pháp bao gồm bước cho lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế, hoặc chế phẩm chứa hợp chất này và ít nhất một trong số các chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn hoặc chất pha loãng dạng lỏng, tiếp xúc với tán lá hoặc bộ phận khác của thực vật không mong muốn hoặc môi trường của thực vật không mong muốn như đất hoặc nước trong đó thực vật không mong muốn đang sinh trưởng hoặc bao quanh hạt hoặc cành chiết khác của thực vật không mong muốn.

Lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế được xác định bằng một số yếu tố. Các yếu tố này bao gồm: chế phẩm được chọn, phương pháp phun, số lượng và loại thực vật có mặt, các điều kiện sinh trưởng, v.v. Nói chung, lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế nằm trong khoảng từ 0,001 đến 20 kg/ha với khoảng được ưu tiên là từ 0,004 đến 1 kg/ha. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ cần thiết cho mức phòng trừ cỏ dại mong muốn.

Theo một phương án chung, hợp chất theo sáng chế được phun, thông thường ở dạng chế phẩm đã chế hóa, vào vị trí có thực vật mong muốn (ví dụ, cây trồng) và thực vật không mong muốn (ví dụ, cỏ), cả hai loại này có thể là hạt giống, cây giống và/hoặc cây trồng lớn hơn, tiếp xúc với môi trường sinh trưởng (ví dụ, đất). Ở vị trí này, chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế có thể được phun trực tiếp vào thực vật hoặc bộ phận của thực vật, đặc biệt là thực vật không mong muốn, và/hoặc vào môi trường sinh trưởng khi tiếp xúc với thực vật.

Các giống thực vật và cây trồng của các loài thực vật mong muốn ở vị trí được xử lý bằng hợp chất theo sáng chế có thể thu được bằng phương pháp nhân giống và truyền giống thông thường hoặc bằng các phương pháp sử dụng kỹ thuật di truyền. Cây trồng biến đổi gen (cây trồng chuyển gen) là các cây trồng trong đó gen khác loài (gen chuyển) đã được hợp nhất một cách ổn định vào bộ gen của cây trồng. Gen chuyển mà được xác định bằng vị trí cụ thể của nó trong bộ gen của cây trồng được gọi là gen biến nạp hoặc gen chuyển.

Cây trồng biến đổi gen có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm các cây trồng có tính kháng một hoặc nhiều áp lực sinh học (loài gây hại như giun tròn, sâu bọ, ve bét, nấm, v.v.) hoặc áp lực phi sinh học (hiện tượng khô hạn, nhiệt độ lạnh, độ mặn của đất, v.v.), hoặc chứa các đặc tính mong muốn khác. Cây trồng có thể được biến đổi về mặt di truyền để có các tính trạng, ví dụ, kháng thuốc diệt cỏ, kháng sâu bọ, cải thiện protein dầu hoặc chống chịu sự khô hạn. Cây trồng biến đổi gen hữu ích chứa gen biến nạp gồm một gen hoặc tổ hợp của các gen biến nạp được thể hiện trong Bảng C. Thông tin bổ sung về biến đổi gen được nêu trong Bảng C có thể thu được từ các cơ sở dữ liệu sẵn có công khai đã được lưu giữ tại, ví dụ, Phòng nông nghiệp Hoa Kỳ.

Các từ viết tắt sau, T1 đến T37, được sử dụng trong Bảng C cho tính trạng. “-” nghĩa là mục nhập không có sẵn; “tol.” nghĩa là “chống chịu” và “res.” nghĩa là kháng.

| Tính trạng | Mô tả                        | Tính trạng | Mô tả                                 | Tính trạng | Mô tả                       |
|------------|------------------------------|------------|---------------------------------------|------------|-----------------------------|
| T1         | Chống chịu Glyphosat         | T15        | Chống chịu lạnh                       | T27        | Lượng tryptophan cao        |
| T2         | Lượng dầu axit lauric cao    | T16        | Chống chịu thuốc diệt cỏ imidazolinon | T28        | Lá thẳng đứng cao hơn lùn   |
| T3         | Chống chịu Glufosinat        | T17        | Lượng alpha-amylaza cải biến          | T29        | Cao hơn lùn                 |
| T4         | Phá vỡ phytat                | T18        | Kiểm soát quá trình thụ phấn          | T30        | Chống chịu kim loại thấp    |
| T5         | Chống chịu Oxynil            | T19        | Chống chịu 2,4-D                      | T31        | Lượng dầu/axit béo cải biến |
| T6         | Kháng bệnh                   | T20        | Lượng lizin tăng                      | T32        | Chống chịu HPPD             |
| T7         | Kháng sâu bọ                 | T21        | Chống chịu khô hạn                    | T33        | Lượng dầu cao               |
| T9         | Màu sắc hoa cải biến         | T22        | Làm chậm quá trình chín/già           | T34        | Chống chịu Aryloxyalkanoat  |
| T11        | Chống chịu thuốc diệt cỏ ALS | T23        | Chất lượng sản phẩm cải biến          | T35        | Chống chịu Mesotrion        |
| T12        | Chống chịu Dicamba           | T24        | Lượng xenluloza cao                   | T36        | Lượng nicotin giảm          |
| T13        | Chống dị ứng                 | T25        | Lượng tinh bột/carbohydrat cải biến   | T37        | Cải biến sản phẩm           |
| T14        | Chống chịu muối              | T26        | Kháng sâu bọ và bệnh                  |            |                             |

Bảng C

| Cây trồng        | Tên gen            | Mã gen      | Tính trạng | Gen                           |
|------------------|--------------------|-------------|------------|-------------------------------|
| Cỏ linh lăng     | J101               | MON-00101-8 | T1         | cp4 epsps (aroA:CP4)          |
| Cỏ linh lăng     | J163               | MON-ØØ163-7 | T1         | cp4 epsps (aroA:CP4)          |
| Cây hạt cải dầu* | 23-18-17 (Gen 18)  | CGN-89465-2 | T2         | te                            |
| Cây hạt cải dầu* | 23-198 (Gen 23)    | CGN-89465-2 | T2         | te                            |
| Cây hạt cải dầu* | 61061              | DP-Ø61Ø61-7 | T1         | gat4621                       |
| Cây hạt cải dầu* | 73496              | DP-Ø73496-4 | T1         | gat4621                       |
| Cây hạt cải dầu* | GT200 (RT200)      | MON-89249-2 | T1         | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Cây hạt cải dầu* | GT73 (RT73)        | MON-ØØØ73-7 | T1         | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Cây hạt cải dầu* | HCN10 (Topas 19/2) | -           | T3         | bar                           |
| Cây hạt cải dầu* | HCN28 (T45)        | ACS-BNØØ8-2 | T3         | pat (syn)                     |
| Cây hạt cải dầu* | HCN92 (Topas 19/2) | ACS-BNØØ7-1 | T3         | bar                           |
| Cây hạt cải dầu* | MON88302           | MON-883Ø2-9 | T1         | cp4 epsps (aroA:CP4)          |

|                  |               |              |       |                             |
|------------------|---------------|--------------|-------|-----------------------------|
| Cây hạt cải dầu* | MPS961        | -            | T4    | phyA                        |
| Cây hạt cải dầu* | MPS962        | -            | T4    | phyA                        |
| Cây hạt cải dầu* | MPS963        | -            | T4    | phyA                        |
| Cây hạt cải dầu* | MPS964        | -            | T4    | phyA                        |
| Cây hạt cải dầu* | MPS965        | -            | T4    | phyA                        |
| Cây hạt cải dầu* | MS1 (B91-4)   | ACS-BNØØ4-7  | T3    | bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | MS8           | ACS-BNØØ5-8  | T3    | bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | OXY-235       | ACS-BNØØ11-5 | T5    | Bxn                         |
| Cây hạt cải dầu* | PHY14         | -            | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | PHY23         | -            | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | PHY35         | -            | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | PHY36         | -            | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | RF1 (B93-101) | ACS-BNØØ1-4  | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | RF2 (B94-2)   | ACS-BNØØ2-5  | T3    | Bar                         |
| Cây hạt cải dầu* | RF3           | ACS-BNØØ3-6  | T3    | Bar                         |
| Cây đậu          | EMBRAPA 5,1   | EMB-PV051-1  | T6    | ac1 (có nghĩa và đối nghĩa) |
| Cà tím #         | EE-1          | -            | T7    | cry1Ac                      |
| Cây bông         | 19-51a        | DD-Ø1951A-7  | T11   | S4-HrA                      |
| Cây bông         | 281-24-236    | DAS-24236-5  | T3,T7 | pat (syn); cry1F            |
| Cây bông         | 3006-210-23   | DAS-21Ø23-5  | T3,T7 | pat (syn); cry1Ac           |
| Cây bông         | 31707         | -            | T5,T7 | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | 31803         | -            | T5,T7 | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | 31807         | -            | T5,T7 | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | 31808         | -            | T5,T7 | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | 42317         | -            | T5,T7 | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | BNLA-601      | -            | T7    | cry1Ac                      |
| Cây bông         | BXN10211      | BXN10211-9   | T5    | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | BXN10215      | BXN10215-4   | T5    | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | BXN10222      | BXN10222-2   | T5    | bxn; cry1Ac                 |
| Cây bông         | BXN10224      | BXN10224-4   | T5    | bxn; cry1Ac                 |

|          |                  |                  |        |                      |
|----------|------------------|------------------|--------|----------------------|
| Cây bông | COT102           | SYN-IR102-7      | T7     | vip3A(a)             |
| Cây bông | COT67B           | SYN-IR67B-1      | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | COT202           | -                | T7     | vip3A                |
| Cây bông | Event 1          | -                | T7     | cry1Ac               |
| Cây bông | GMF Cry1A        | GTL-<br>GMF311-7 | T7     | cry1Ab-Ac            |
| Cây bông | GHB119           | BCS-GH005-<br>8  | T7     | cry2Ae               |
| Cây bông | GHB614           | BCS-GH002-<br>5  | T1     | 2mepsps              |
| Cây bông | GK12             | -                | T7     | cry1Ab-Ac            |
| Cây bông | LLCotton25       | ACS-GH001-<br>3  | T3     | Bar                  |
| Cây bông | MLS 9124         | -                | T7     | cry1C                |
| Cây bông | MON1076          | MON-89924-<br>2  | T7     | cry1Ac               |
| Cây bông | MON1445          | MON-01445-<br>2  | T1     | Cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Cây bông | MON15985         | MON-15985-<br>7  | T7     | cry1Ac; cry2Ab2      |
| Cây bông | MON1698          | MON-89383-<br>1  | T7     | Cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Cây bông | MON531           | MON-00531-<br>6  | T7     | cry1Ac               |
| Cây bông | MON757           | MON-00757-<br>7  | T7     | cry1Ac               |
| Cây bông | MON88913         | MON-88913-<br>8  | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Cây bông | Nqwe Chi 6 Bt    | -                | T7     | -                    |
| Cây bông | SKG321           | -                | T7     | cry1A; CpTI          |
| Cây bông | T303-3           | BCS-GH003-<br>6  | T3,T7  | cry1Ab; bar          |
| Cây bông | T304-40          | BCS-GH004-<br>7  | T3,T7  | cry1Ab; bar          |
| Cây bông | CE43-67B         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | CE46-02A         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | CE44-69D         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | 1143-14A         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | 1143-51B         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | T342-142         | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | PV-GHGT07 (1445) | -                | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Cây bông | EE-GH3           | -                | T1     | mepsps               |
| Cây bông | EE-GH5           | -                | T7     | cry1Ab               |
| Cây bông | MON88701         | MON-88701-<br>3  | T3,T12 | dmo; bar cải biến    |
| Cây bông | OsCr11           | -                | T13    | Cry j cải biến       |

|                 |                   |              |        |                                          |
|-----------------|-------------------|--------------|--------|------------------------------------------|
| Cây lanh        | FP967             | CDC-FL001-2  | T11    | als                                      |
| Cây đậu<br>lăng | RH44              | -            | T16    | als                                      |
| Cây ngô         | 3272              | SYN-E3272-5  | T17    | amy797E                                  |
| Cây ngô         | 5307              | SYN-05307-1  | T7     | ecry3,1Ab                                |
| Cây ngô         | 59122             | DAS-59122-7  | T3,T7  | cry34Ab1; cry35Ab1; pat                  |
| Cây ngô         | 676               | PH-000676-7  | T3,T18 | pat; dam                                 |
| Cây ngô         | 678               | PH-000678-9  | T3,T18 | pat; dam                                 |
| Cây ngô         | 680               | PH-000680-2  | T3,T18 | pat; dam                                 |
| Cây ngô         | 98140             | DP-098140-6  | T1,T11 | gat4621; zm-hra                          |
| Cây ngô         | Bt10              | -            | T3,T7  | cry1Ab; pat                              |
| Cây ngô         | Bt176 (176)       | SYN-EV176-9  | T3,T7  | cry1Ab; bar                              |
| Cây ngô         | BVLA430101        | -            | T4     | phyA2                                    |
| Cây ngô         | CBH-351           | ACS-ZM004-3  | T3,T7  | cry9C; bar                               |
| Cây ngô         | DAS40278-9        | DAS40278-9   | T19    | aad-1                                    |
| Cây ngô         | DBT418            | DKB-89614-9  | T3,T7  | cry1Ac; pinII; bar                       |
| Cây ngô         | DLL25 (B16)       | DKB-89790-5  | T3     | bar                                      |
| Cây ngô         | GA21              | MON-00021-9  | T1     | mepsps                                   |
| Cây ngô         | GG25              | -            | T1     | mepsps                                   |
| Cây ngô         | GJ11              | -            | T1     | mepsps                                   |
| Cây ngô         | Fl117             | -            | T1     | mepsps                                   |
| Cây ngô         | GAT-ZM1           | -            | T3     | pat                                      |
| Cây ngô         | LY038             | REN-00038-3  | T20    | cordapA                                  |
| Cây ngô         | MIR162            | SYN-IR162-4  | T7     | vip3Aa20                                 |
| Cây ngô         | MIR604            | SYN-IR604-5  | T7     | mcry3A                                   |
| Cây ngô         | MON801 (MON80100) | MON801       | T1,T7  | cry1Ab; cp4 epsps<br>(aroA:CP4); goxv247 |
| Cây ngô         | MON802            | MON-80200-7  | T1,T7  | cry1Ab; cp4 epsps<br>(aroA:CP4); goxv247 |
| Cây ngô         | MON809            | PH-MON-809-2 | T1,T7  | cry1Ab; cp4 epsps<br>(aroA:CP4); goxv247 |
| Cây ngô         | MON810            | MON-00810-6  | T1,T7  | cry1Ab; cp4 epsps<br>(aroA:CP4); goxv247 |
| Cây ngô         | MON832            | -            | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4);<br>goxv247         |
| Cây ngô         | MON863            | MON-00863-5  | T7     | cry3Bb1                                  |
| Cây ngô         | MON87427          | MON-87427-7  | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4)                     |
| Cây ngô         | MON87460          | MON-87460-4  | T21    | cspB                                     |

|                   |                 |             |        |                                |
|-------------------|-----------------|-------------|--------|--------------------------------|
| Cây ngô           | MON88017        | MON-88017-3 | T1,T7  | cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)  |
| Cây ngô           | MON89034        | MON-89034-3 | T7     | cry2Ab2; cry1A.105             |
| Cây ngô           | MS3             | ACS-ZM001-9 | T3,T18 | bar; barnaza                   |
| Cây ngô           | MS6             | ACS-ZM005-4 | T3,T18 | bar; barnaza                   |
| Cây ngô           | NK603           | MON-00603-6 | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4)           |
| Cây ngô           | T14             | ACS-ZM002-1 | T3     | pat (syn)                      |
| Cây ngô           | T25             | ACS-ZM003-2 | T3     | pat (syn)                      |
| Cây ngô           | TC1507          | DAS-01507-1 | T3,T7  | cry1Fa2; pat                   |
| Cây ngô           | TC6275          | DAS-06275-8 | T3,T7  | mocry1F; bar                   |
| Cây ngô           | VIP1034         | -           | T3,T7  | Vip3A; pat                     |
| Cây ngô           | 43A47           | DP-043A47-3 | T3,T7  | cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat |
| Cây ngô           | 40416           | DP-040416-8 | T3,T7  | cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat |
| Cây ngô           | 32316           | DP-032316-8 | T3,T7  | cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat |
| Cây ngô           | 4114            | DP-004114-3 | T3,T7  | cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat |
| Cây dưa           | Melon A         | -           | T22    | sam-k                          |
| Cây dưa           | Melon B         | -           | T22    | sam-k                          |
| Cây đu đủ         | 55-1            | CUH-CP551-8 | T6     | prsv cp                        |
| Cây đu đủ         | 63-1            | CUH-CP631-7 | T6     | prsv cp                        |
| Cây đu đủ         | Huanong No. 1   | -           | T6     | prsv rep                       |
| Cây đu đủ         | X17-2           | UFL-X17CP-6 | T6     | prsv cp                        |
| Cây mận           | C-5             | ARS-PLMC5-6 | T6     | ppv cp                         |
| Cây hạt cải dầu** | ZSR500          | -           | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247  |
| Cây hạt cải dầu** | ZSR502          | -           | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247  |
| Cây hạt cải dầu** | ZSR503          | -           | T1     | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247  |
| Cây lúa           | 7Crp#242-95-7   | -           | T13    | 7crp                           |
| Cây lúa           | 7Crp#10         | -           | T13    | 7crp                           |
| Cây lúa           | GM Shanyou 63   | -           | T7     | Cry1Ab; cry1Ac                 |
| Cây lúa           | Huahui-1/TT51-1 | -           | T7     | Cry1Ab; cry1Ac                 |
| Cây lúa           | LLCÂY LÚA06     | ACS-OS001-4 | T3     | Bar                            |

|               |                              |             |     |                            |
|---------------|------------------------------|-------------|-----|----------------------------|
| Cây lúa       | LLCÂY LÚA601                 | BCS-OS003-7 | T3  | Bar                        |
| Cây lúa       | LLCÂY LÚA62                  | ACS-OS002-5 | T3  | Bar                        |
| Cây lúa       | Tarom molaii + cry1Ab        | -           | T7  | cry1Ab (cụt)               |
| Cây lúa       | GAT-OS2                      | -           | T3  | Bar                        |
| Cây lúa       | GAT-OS3                      | -           | T3  | Bar                        |
| Cây lúa       | PE-7                         | -           | T7  | Cry1Ac                     |
| Cây lúa       | 7Crp#10                      | -           | T13 | 7crp                       |
| Cây lúa       | KPD627-8                     | -           | T27 | OASA1D                     |
| Cây lúa       | KPD722-4                     | -           | T27 | OASA1D                     |
| Cây lúa       | KA317                        | -           | T27 | OASA1D                     |
| Cây lúa       | HW5                          | -           | T27 | OASA1D                     |
| Cây lúa       | HW1                          | -           | T27 | OASA1D                     |
| Cây lúa       | B-4-1-18                     | -           | T28 | $\Delta$ OsBRI1            |
| Cây lúa       | G-3-3-22                     | -           | T29 | OSGA2ox1                   |
| Cây lúa       | AD77                         | -           | T6  | DEF                        |
| Cây lúa       | AD51                         | -           | T6  | DEF                        |
| Cây lúa       | AD48                         | -           | T6  | DEF                        |
| Cây lúa       | AD41                         | -           | T6  | DEF                        |
| Cây lúa       | 13pNasNa800725atAprt1        | -           | T30 | HvNAS1; HvNAAT-A; APRT     |
| Cây lúa       | 13pAprt1                     | -           | T30 | APRT                       |
| Cây lúa       | gHvNAS1-gHvNAAT-1            | -           | T30 | HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B |
| Cây lúa       | gHvIDS3-1                    | -           | T30 | HvIDS3                     |
| Cây lúa       | gHvNAAT1                     | -           | T30 | HvNAAT-A; HvNAAT-B         |
| Cây lúa       | gHvNAS1-1                    | -           | T30 | HvNAS1                     |
| Cây lúa       | NIA-OS006-4                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | NIA-OS005-3                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | NIA-OS004-2                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | NIA-OS003-1                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | NIA-OS002-9                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | NIA-OS001-8                  | -           | T6  | WRKY45                     |
| Cây lúa       | OsCr11                       | -           | T13 | Cry j cải biến             |
| Cây lúa       | 17053                        | -           | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4)       |
| Cây lúa       | 17314                        | -           | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4)       |
| Cây hoa hồng  | WKS82 / 130-4-1              | IFD-52401-4 | T9  | 5AT; bp40 (f3'5'h)f3'5'h)  |
| Cây hoa hồng  | WKS92 / 130-9-1              | IFD-52901-9 | T9  | 5AT; bp40 (f3'5'h)         |
| Cây đậu tương | 260-05 (G94-1, G94-19, G168) | -           | T9  | gm-fad2-1 (locut câm)      |

|               |                     |             |           |                                                                                        |
|---------------|---------------------|-------------|-----------|----------------------------------------------------------------------------------------|
| Cây đậu tương | A2704-12            | ACS-GM005-3 | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | A2704-21            | ACS-GM004-2 | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | A5547-127           | ACS-GM006-4 | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | A5547-35            | ACS-GM008-6 | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | CV127               | BPS-CV127-9 | T16       | csr1-2                                                                                 |
| Cây đậu tương | DAS68416-4          | DAS68416-4  | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | DP305423            | DP-305423-1 | T11,T31   | gm-fad2-1 (locut câm);<br>gm-hra                                                       |
| Cây đậu tương | DP356043            | DP-356043-5 | T1,T31    | gm-fad2-1 (locut câm);<br>gat4601                                                      |
| Cây đậu tương | FG72                | MST-FG072-3 | T32,T1    | 2mepsps; hppdPF W336                                                                   |
| Cây đậu tương | GTS 40-3-2 (40-3-2) | MON-04032-6 | T1        | cp4 epsps (aroA:CP4)                                                                   |
| Cây đậu tương | GU262               | ACS-GM003-1 | T3        | Pat                                                                                    |
| Cây đậu tương | MON87701            | MON-87701-2 | T7        | cry1Ac                                                                                 |
| Cây đậu tương | MON87705            | MON-87705-6 | T1,T31    | fatb1-A (có nghĩa và đối nghĩa); fad2-1A (có nghĩa và đối nghĩa); cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Cây đậu tương | MON87708            | MON-87708-9 | T1,T12    | dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)                                                              |
| Cây đậu tương | MON87769            | MON-87769-7 | T1,T31    | Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)                                                  |
| Cây đậu tương | MON89788            | MON-89788-1 | T1        | cp4 epsps (aroA:CP4)                                                                   |
| Cây đậu tương | W62                 | ACS-GM002-9 | T3        | bar                                                                                    |
| Cây đậu tương | W98                 | ACS-GM001-8 | T3        | bar                                                                                    |
| Cây đậu tương | MON87754            | MON-87754-1 | T33       | Dgat2A                                                                                 |
| Cây đậu tương | DAS21606            | DAS-21606   | T34,T3    | aad-12; pat cải biến                                                                   |
| Cây đậu tương | DAS44406            | DAS-44406-6 | T1,T3,T34 | aad-12; 2mepsps; pat cải biến                                                          |
| Cây đậu tương | SYHT04R             | SYN-0004R-8 | T35       | Avhppd cải biến                                                                        |
| Cây đậu tương | 9582,814,19,1       | -           | T3,T7     | cry1Ac, cry1F, PAT                                                                     |
| Cây bí        | CZW3                | SEM-ØCZW3-2 | T6        | cmv cp, zymv cp, wmv cp                                                                |

|                     |                   |             |     |                               |
|---------------------|-------------------|-------------|-----|-------------------------------|
| Cây bí              | ZW20              | SEM-0ZW20-7 | T6  | zymv cp, wmv cp               |
| Cây củ cải đường    | GTSB77 (T9100152) | SY-GTSB77-8 | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Cây củ cải đường    | H7-1              | KM-000H71-4 | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4)          |
| Cây củ cải đường    | T120-7            | ACS-BV001-3 | T3  | pat                           |
| Cây củ cải đường    | T227-1            | -           | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4)          |
| Cây mía             | NXI-1T            | -           | T21 | EcbetA                        |
| Cây hoa hướng dương | X81359            | -           | T16 | als                           |
| Cây hạt tiêu        | PK-SP01           | -           | T6  | cmv cp                        |
| Cây thuốc lá        | C/F/93/08-02      | -           | T5  | bxn                           |
| Cây thuốc lá        | Vật truyền 21-41  | -           | T36 | NtQPT1 (đối nghĩa)            |
| Cây hoa hướng dương | X81359            | -           | T16 | als                           |
| Cây lúa mì          | MON71800          | MON-71800-3 | T1  | cp4 epsps (aroA:CP4)          |

\* Ac-hen-ti-na (*Brassica napus*), \*\* Ba Lan (*B. rapa*), # Cây cà tím

Thông thường, mặc dù phần lớn hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát thực vật không mong muốn, cho thực vật không mong muốn ở vị trí cần xử lý tiếp xúc với hợp chất theo sáng chế có thể tạo ra tác dụng siêu cộng hợp hoặc tác dụng hiệp đồng với các tính trạng di truyền ở thực vật không mong muốn, bao gồm các tính trạng được đưa vào để biến đổi gen. Ví dụ, tính kháng sâu bọ gây bệnh thực vật hoặc các bệnh của thực vật, tính chống chịu các áp lực sinh học/phi sinh học hoặc độ ổn định bảo quản có thể dự định lớn hơn so với các tính trạng di truyền ở thực vật không mong muốn.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc nhiều hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc diệt dục, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất dẫn dụ côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus hoặc nấm để tạo ra thuốc trừ sâu nhiều thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1 (với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ), và ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác (với lượng hữu hiệu sinh học) và có thể còn chứa ít nhất một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn hoặc chất pha loãng dạng lỏng. Hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác có thể được pha chế ở dạng chế phẩm chứa ít nhất

một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn hoặc chất pha loãng dạng lỏng. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác có thể được điều chế cùng với chế phẩm theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức 1, để tạo ra hỗn hợp sơ chế, hoặc các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ chế phẩm theo sáng chế, chứa hợp chất có công thức 1, và hai chế phẩm được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Hỗn hợp chứa một hoặc nhiều thuốc diệt cỏ sau với hợp chất theo sáng chế có thể đặc biệt hữu ích để phòng trừ cỏ dại: axetoclo, axiflofen và muối natri của nó, aclonifen, acrolein (2-propenal), alaclo, aloxydim, ametryn, amicarbazone, amitosulfuron, aminoxyclopyrachlor và este của nó (ví dụ, metyl, etyl) và các muối (ví dụ, natri, kali), aminopyralit, amitrol, amoni sulfamat, anilofos, asulam, atrazin, azimsulfuron, beflubutamat, benazolin, benazolin-ethyl, bencarbazone, benfluralin, benfuresat, bensulfuron-metyl, bensulit, bentazon, benzobixyclon, benzofenap, bixyclopyron, bifenox, bilanafos, bispyribac và muối natri của nó, bromaxil, bromobutit, bromofenoxim, bromoxynil, bromoxynil octanoat, butaclo, butafenaxil, butamifos, butralin, butroxydim, butylat, cafenstrol, carbetamat, carfentrazone-ethyl, catechin, clometoxyfen, cloramben, clorbromuron, clorflurenol-metyl, cloridazon, clorimuron-ethyl, clotoluron, clorpropham, closulfuron, clorthal-dimetyl, clorhiamid, xinidon-ethyl, xinmetylin, xinosulfuron, clacyfos, clefoxydim, clethodim, xyclopyrimorat, clodinafop-propargyl, clomazon, clomeprop, clopyralit, clopyralit-olamin, cloransulam-metyl, cumyluron, xyanazin, xycloat, xyclopyrimorat, xyclosulfamuron, xycloxydim, xyhalofop-butyl, 2,4-D và butotyl của nó, butyl, isootyl và este isopropyl và dimethylamoni của nó, diolamin và muối trolamin, daimuron, dalapon, dalapon-natri, dazomet, 2,4-DB và dimethylamoni của nó, các muối kali và natri, desmedipham, desmetryn, dicamba và diglycolamoni của nó, dimethylamoni, các muối kali và natri, diclobenil, dicloprop, diclofop-metyl, diclosulam, difenzoquat metilsulfat, dflufenican, dflufenzopir, dimefuron, dimepiperat, dimethaclor, dimethametryn, dimethenamid, dimethenamid-P, dimethipin, axit dimethylarsinic và muối natri của nó, dinitramin, dinoterb, diphenamid, điquat đibromua, dithiopyr, đirun, DNOC, endothal, EPTC, esprocarb, etalfluralin, etametsulfuron-metyl, ethiozin, ethofumesat, etoxyfen, etoxysulfuron, etobenzanil, fenoxaprop-ethyl, fenoxaprop-P-ethyl, fenoxasulfon, fenquinotrin, fenitrazamid, fenuron, fenuron-TCA, flamprop-metyl, flamprop-M-isopropyl, flamprop-M-metyl, flazasulfuron, florasulam, fluazifop-butyl, fluazifop-P-butyl, fluazolat, flucarbazone, flucetosulfuron, flucloralin, flufenaxet, flufenpyr, flufenpyr-ethyl, flumetsulam, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, fluometuron, floglycofen-ethyl, flupoxam, flupyrsulfuron-metyl và muối natri của nó, flurenol, flurenol-butyl, fluridon, flurocloridon, fluroxypir, flurtamon, fluthiaxet-metyl, fomesafen, foramsulfuron, fosamin-amoni, glufosinat, glufosinat-amoni, glufosinat-P, glyphosat và các muối của nó như amoni, isopropylamoni, kali, natri (bao gồm sesquinati) và trimesium (được gọi theo cách khác là sulfosat), halauxifen, halauxifen-metyl, halosulfuron-metyl, haloxyfop-etotyl, haloxyfop-metyl, hexazinon, imazametabenz-

metyl, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazaquin-amoni, imazetapyr, imazetapyr-amoni, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iofensulfuron, iodosulfuron-metyl, ioxynil, ioxynil octanoat, ioxynil-natri, ipfencarbazon, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutol, isoxaclortol, lactofen, lenaxil, linuron, maleic hydrazit, MCPA và các muối của nó (ví dụ, MCPA-dimethylamoni, MCPA-kali và MCPA-natri, este (ví dụ, MCPA-2-etylhexyl, MCPA-butotyl) và thioeste (ví dụ, MCPA-thioetyl), MCPB và các muối của nó (ví dụ, MCPB-natri) và este (ví dụ, MCPB-etyl), mecoprop, mecoprop-P, mefenaxet, mefluidit, mesosulfuron-metyl, mesotrion, metam-natri, metamifop, metamitron, metazaclo, metazosulfuron, methabenzthiazuron, axit metylarsonic và canxi của nó, monoamoni, muối mononatri và dinatri, metylđymron, metobenzuron, metobromuron, metolaclo, S-metolaclo, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron-metyl, molinat, monolinuron, naproanilit, napropamit, napropamit-M, naptalam, neburon, nicosulfuron, norflurazon, orbencarb, orthosulfamuron, oryzalin, oxadiargyl, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxyfluorfen, paraquat diclorua, pebulat, axit pelargonic, pendimetalin, penoxsulam, pentanoclor, pentoxazon, perfluidon, pethoxamit, petoxyamit, phenmedipham, picloram, picloram-kali, picolinafen, pinoxaden, piperophos, pretilaclo, primisulfuron-metyl, prodiamin, profoxydim, prometon, prometryn, propaclo, propanil, propaquizafop, propazin, propham, propisoclo, propoxycarbazon, propyrisulfuron, propyzamit, prosulfocarb, prosulfuron, pyracilonil, pyraflufen-etyl, pyrasulfotol, pyrazogyl, pyrazolynat, pyrazoxyfen, pyrazosulfuron-etyl, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridat, pyriftalit, pyriminobacmetyl, pyrimisulfan, pyrithiobac, pyrithiobac-natri, pyroxasulfon, pyroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinclamin, quizalofop-etyl, quizalofop-P-etyl, quizalofop-P-tefuryl, rimsulfuron, saflufenacil, setoxydim, siduron, simazin, simetryn, sulcotrion, sulfentrazon, sulfometuron-metyl, sulfosulfuron, 2,3,6-TBA, TCA, TCA-natri, tebutam, tebuthiuron, tefuryltrion, tembotrion, tepraloxym, terbacil, terbumeton, terbutylazin, terbutryn, thenylclo, thiazopyr, thiencarbazon, thifensulfuron-metyl, thiobencarb, tiafenacil, tiocarbazil, topramezon, tralkoxydim, tri-allat, triafamon, triasulfuron, triaziflam, tribenuron-metyl, triclopyr, triclopyr-butotyl, triclopyr-triethylamoni, tridiphan, trietazin, trifloxysulfuron, trifluralin, triflusulfuron-metyl, tritosulfuron, vernolat, 3-(2-clo-3,6-điflophenyl)-4-hydroxy-1-metyl-1,5-naphthyridin-2(1H)-on, 5-clo-3-[(2-hydroxy-6-oxo-1-xyclohexen-1-yl)cacbonyl]-1-(4-metoxypheyl)-2(1H)-quinoxalinon, 2-clo-N-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)-6-(triflometyl)-3-pyridincaboxamit, 7-(3,5-diclo-4-pyridinyl)-5-(2,2-đifloetyl)-8-hydroxypyrido[2,3-b]pyrazin-6(5H)-on, 4-(2,6-đietyl-4-metylphenyl)-5-hydroxy-2,6-dimetyl-3(2H)-pyridazinon, 5-[(2,6-điflophenyl)metoxy]metyl]-4,5-dihydro-5-metyl-3-(3-metyl-2-thienyl)isoxazol (previously methioxolin), 3-[7-flo-3,4-đihydro-3-oxo-4-(2-propyn-1-yl)-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]dihydro-1,5-dimetyl-6-thioxo-1,3,5-triazin-2,4(1H,3H)-đion, 4-(4-flophenyl)-6-[(2-hydroxy-6-oxo-1-xyclohexen-1-yl)cacbonyl]-2-metyl-1,2,4-triazin-3,5(2H,4H)-đion, metyl 4-amino-3-clo-6-(4-clo-2-flo-3-metoxypheyl)-5-flo-2-pyridincaboxylat, 2-metyl-3-(metylsulfonyl)-N-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)-4-(triflometyl)benzamit, và 2-metyl-N-(4-metyl-1,2,5-oxadiazol-3-yl)-3-

(metylsulfinyl)-4-(triflometyl)benzamid. Thuốc diệt cỏ khác cũng bao gồm các thuốc diệt cỏ sinh học như *Alternaria destruens* Simmons, *Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. & Sacc., *Drechslera monoceras* (MTB-951), *Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries, *Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl. và *Puccinia thlaspeos* Schub.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng kết hợp với chất điều hòa sinh trưởng thực vật như aviglyxin, *N*-(phenylmetyl)-1*H*-purin-6-amin, epocholeon, gibberellic axit, gibberelin A<sub>4</sub> và A<sub>7</sub>, harpin protein, mepiquat clorua, prohexadion canxi, prohydrojasmon, natri nitrophenolat và trinexapac-metyl, và sinh vật cải biến sinh trưởng thực vật như chủng *Bacillus cereus* BP01.

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

Đối với các phương án trong đó một hoặc nhiều thành phần phối trộn khác nhau này được sử dụng, thì các thành phần phối trộn này thường được sử dụng với lượng thông thường khi các thành phần của hỗn hợp được sử dụng riêng rẽ. Cụ thể hơn trong hỗn hợp, các thành phần hoạt tính thường được phun ở tỷ lệ phun bằng một nửa đến bằng tỷ lệ phun được chỉ rõ trên nhãn sản phẩm để dùng cho thành phần hoạt tính riêng rẽ. Các lượng này được nêu trong các tài liệu tham khảo như *The Pesticide Manual* and *The BioPesticide Manual*. Tỷ lệ khối lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) với hợp chất có công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Tốt hơn là, tỷ lệ khối lượng này nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Điều hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ cỏ dại vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất có công thức 1.

Trong các trường hợp nhất định, hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế với khác hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học (thuốc diệt cỏ cụ thể) (tức là các thành phần hoạt tính) có thể dẫn đến tạo ra hiệu quả cộng hợp lớn hơn (tức là hiệu quả hiệp đồng) đối với cỏ dại và/hoặc hiệu quả cộng hợp thấp hơn (tức là hiệu quả an toàn) đối với cây trồng hoặc các thực vật mong muốn khác. Vẫn luôn mong muốn làm giảm được số lượng các thành phần hoạt tính được giải phóng trong môi trường trong khi vẫn đảm bảo phòng trừ loài gây hại một cách hiệu quả. Cũng mong muốn có thể sử dụng lượng lớn hơn các thành phần hoạt tính để thu được hiệu quả phòng trừ cỏ dại cao

hơn mà không gây tổn thương cây trồng quá mức. Khi hiệu quả hiệp đồng của các thành phần có tác dụng diệt cỏ xảy ra đối với cỏ dại ở các tỷ lệ dùng thu được mức phòng trừ cỏ dại thỏa mãn trong nông nghiệp, các hỗn hợp như vậy có thể có lợi trong việc làm giảm chi phí sản xuất vụ mùa và làm giảm gánh nặng về mặt môi trường. Khi làm an toàn các thành phần có tác dụng diệt cỏ xảy ra đối với cây trồng, các hỗn hợp như vậy có thể có lợi để làm tăng sự bảo vệ mùa màng bằng cách làm giảm tính cạnh tranh cỏ dại.

Tốt hơn là, hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế với ít nhất một hoạt chất diệt cỏ khác. Tốt hơn nữa là, hỗn hợp như vậy có hoạt chất diệt cỏ khác có vị trí tác động khác nhau từ hợp chất theo sáng chế. Trong các trường hợp nhất định, hỗn hợp với ít nhất một hoạt chất diệt cỏ khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ đặc biệt có lợi để quản lý tính kháng. Do vậy, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm (với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ) ít nhất một hoạt chất diệt cỏ bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng kết hợp với chất an toàn diệt cỏ (safener) như allidoclor, benoxacor, cloquintocet-mexyl, cumyluron, xyometrinil, cyprosulfonamid, daimuron, diclomit, dixyclonon, dietholat, dimepiperat, fenclorazol-ethyl, fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen-ethyl, mefenpyr-dietyl, mephenat, metoxyphenon anhydrit naphtalic (1,8-anhydrit naphtalic), oxabetrinil, *N*-(aminocarbonyl)-2-metylbenzensulfonamid, *N*-(aminocarbonyl)-2-flobenzensulfonamid, 1-bromo-4-[(clometyl)sulfonyl]benzen (BCS), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azospiro[4,5]đecan (MON 4660), 2-(diclometyl)-2-metyl-1,3-đioxolan (MG 191), etyl 1,6-đihydro-1-(2-metoxypheyl)-6-oxo-2-phenyl-5-pyrimidincarboxylat, 2-hydroxy-*N,N*-dimetyl-6-(triflometyl)pyridin-3-carboxamid, và 3-oxo-1-xyclohexen-1-yl 1-(3,4-dimetylphenyl)-1,6-đihydro-6-oxo-2-phenyl-5-pyrimidincarboxylat, 2,2-diclo-1-(2,2,5-trimetyl-3-oxazolitiny)-etanon và 2-metoxi-*N*-[[4-[[[(metylamino)carbonyl]amino]phenyl]sulfonyl]-benzamid để làm tăng an toàn cho các cây trồng nhất định. Lượng hữu hiệu có tác dụng giải độc của chất an toàn diệt cỏ (safener) có thể được phun đồng thời dưới dạng hợp chất theo sáng chế, hoặc được phun dưới dạng chất xử lý hạt. Vì vậy, theo một khía cạnh, sáng chế đề xuất hỗn hợp diệt cỏ chứa hợp chất theo sáng chế và lượng hữu hiệu có tác dụng giải độc của chất an toàn diệt cỏ (safener). Việc xử lý hạt là đặc biệt hữu ích để phòng trừ cỏ dại một cách chọn lọc, bởi vì nó giới hạn về mặt sinh lý việc giải độc cho cây trồng. Vì vậy, một phương án đặc biệt hữu ích theo sáng chế là phương pháp phòng trừ một cách có chọn lọc sự sinh trưởng của thực vật không mong muốn ở cây trồng bao gồm bước cho vị trí của cây trồng tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo sáng chế trong đó hạt mà từ đó cây trồng sinh trưởng được xử lý bằng

lượng hữu hiệu có tác dụng giải độc của chất an toàn. Lượng hữu hiệu có tác dụng giải độc của chất an toàn có thể được xác định một cách dễ dàng bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này thông qua thử nghiệm đơn giản.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với: (1) polynucleotit bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, ADN, ARN, và/hoặc nucleotit được cải biến bằng hóa học tác động đến lượng đích cụ thể đến quá trình điều hòa dưới, sự can thiệp, ức chế hoặc làm câm sản phẩm phiên mã có nguồn gốc di truyền mà tạo ra hiệu quả diệt cỏ; hoặc (2) polynucleotit bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, ADN, ARN, và/hoặc nucleotit được cải biến bằng hóa học tác động đến lượng đích cụ thể đến quá trình điều hòa dưới, sự can thiệp, ức chế hoặc làm câm sản phẩm phiên mã có nguồn gốc di truyền mà tạo ra hiệu quả an toàn.

Tốt hơn là, chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế (với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ), ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm thuốc diệt cỏ khác và chất an toàn diệt cỏ (safener) (với lượng hữu hiệu), và ít nhất một thành phần được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng.

Ưu tiên để phòng trừ tốt hơn thực vật không mong muốn (ví dụ, tỷ lệ sử dụng thấp hơn như hiệu quả cộng hợp, phổ phòng trừ cỏ dại rộng hơn, hoặc độ an toàn cho mùa màng tăng) hoặc để ngăn ngừa sự phát triển cỏ có tính kháng là hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế với thuốc diệt cỏ khác. Bảng A1 liệt kê hỗn hợp cụ thể của thành phần (a) (tức là hợp chất cụ thể theo sáng chế) với thuốc diệt cỏ khác dưới dạng thành phần (b) minh họa cho hỗn hợp của chế phẩm và phương pháp theo sáng chế. Hợp chất 17 trong cột Thành phần (a) được xác định trong Bảng chỉ số A. Cột thứ hai của Bảng A1 liệt kê hợp chất (ví dụ, “2,4-D” trong dòng thứ nhất) với Thành phần (b) cụ thể. Các cột thứ ba, thứ tư, thứ năm của Bảng A1 liệt kê khoảng tỷ lệ khối lượng cho các tỷ lệ mà tại đó hợp chất chứa thành phần (a) thường được phun lên cây trồng sinh trưởng trên cánh đồng so với thành phần (b) (tức là (a):(b)). Do vậy, ví dụ, dòng thứ nhất của Bảng A1 thể hiện một cách rõ ràng tổ hợp của thành phần (a) (tức là Hợp chất 17 trong Bảng chỉ số A) với 2,4-D thường được phun với tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:192 đến 6:1. Các dòng còn lại của Bảng A1 được cấu trúc theo cách tương tự.

Bảng A1

| <u>Thành phần (a)</u><br>(Hợp chất #) | <u>Thành phần (b)</u> | Tỷ lệ khối lượng được ưu tiên | Tỷ lệ khối lượng được ưu tiên hơn | Tỷ lệ khối lượng được ưu tiên nhất |
|---------------------------------------|-----------------------|-------------------------------|-----------------------------------|------------------------------------|
| 1                                     | 2,4-D                 | 1:192 – 6:1                   | 1:64 – 2:1                        | 1:24 – 1:3                         |
| 1                                     | Acetochlor            | 1:768 – 2:1                   | 1:256 – 1:2                       | 1:96 – 1:11                        |
| 1                                     | Acifluorfen           | 1:96 – 12:1                   | 1:32 – 4:1                        | 1:12 – 1:2                         |
| 1                                     | Aclonifen             | 1:857 – 2:1                   | 1:285 – 1:3                       | 1:107 – 1:12                       |
| 1                                     | Alachlor              | 1:768 – 2:1                   | 1:256 – 1:2                       | 1:96 – 1:11                        |

|   |                      |              |             |              |
|---|----------------------|--------------|-------------|--------------|
| 1 | Ametryn              | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Amicarbazone         | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Amidosulfuron        | 1:6 – 168:1  | 1:2 – 56:1  | 1:1 – 11:1   |
| 1 | Aminocyclopyrachlor  | 1:48 – 24:1  | 1:16 – 8:1  | 1:6 – 2:1    |
| 1 | Aminopyralid         | 1:20 – 56:1  | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Amitrole             | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Anilofos             | 1:96 – 12:1  | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Asulam               | 1:960 – 2:1  | 1:320 – 1:3 | 1:120 – 1:14 |
| 1 | Atrazine             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Azimsulfuron         | 1:6 – 168:1  | 1:2 – 56:1  | 1:1 – 11:1   |
| 1 | Beflubutamid         | 1:342 – 4:1  | 1:114 – 2:1 | 1:42 – 1:5   |
| 1 | Benfuresate          | 1:617 – 2:1  | 1:205 – 1:2 | 1:77 – 1:9   |
| 1 | Bensulfuron-methyl   | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Bentazone            | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Benzobicyclon        | 1:85 – 14:1  | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Benzofenap           | 1:257 – 5:1  | 1:85 – 2:1  | 1:32 – 1:4   |
| 1 | Bicyclopyrone        | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Bifenox              | 1:257 – 5:1  | 1:85 – 2:1  | 1:32 – 1:4   |
| 1 | Bispyribac-sodium    | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Bromacil             | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Bromobutide          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Bromoxynil           | 1:96 – 12:1  | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Butachlor            | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Butafenacil          | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Butylate             | 1:1542 – 1:2 | 1:514 – 1:5 | 1:192 – 1:22 |
| 1 | Carfenstrole         | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Carfentrazone-ethyl  | 1:128 – 9:1  | 1:42 – 3:1  | 1:16 – 1:2   |
| 1 | Chlorimuron-ethyl    | 1:8 – 135:1  | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Chlorotoluron        | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Chlorsulfuron        | 1:6 – 168:1  | 1:2 – 56:1  | 1:1 – 11:1   |
| 1 | Cincosulfuron        | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Cinidon-ethyl        | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Cinmethylin          | 1:34 – 34:1  | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Clacyfos             | 1:34 – 34:1  | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Clethodim            | 1:48 – 24:1  | 1:16 – 8:1  | 1:6 – 2:1    |
| 1 | Clodinafop-propargyl | 1:20 – 56:1  | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Clomazone            | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Clomeprop            | 1:171 – 7:1  | 1:57 – 3:1  | 1:21 – 1:3   |
| 1 | Clopyralid           | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Cloransulam-methyl   | 1:12 – 96:1  | 1:4 – 32:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Cumyluron            | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Cyanazine            | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Cyclopyrimorate      | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Cyclosulfamuron      | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Cycloxydim           | 1:96 – 12:1  | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Cyhalofop            | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Daimuron             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Desmedipham          | 1:322 – 4:1  | 1:107 – 2:1 | 1:40 – 1:5   |
| 1 | Dicamba              | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Dichlobenil          | 1:1371 – 1:2 | 1:457 – 1:4 | 1:171 – 1:20 |
| 1 | Dichlorprop          | 1:925 – 2:1  | 1:308 – 1:3 | 1:115 – 1:13 |
| 1 | Diclofop-methyl      | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Diclosulam           | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Difenzoquat          | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Diffenican           | 1:857 – 2:1  | 1:285 – 1:3 | 1:107 – 1:12 |

|   |                        |               |             |              |
|---|------------------------|---------------|-------------|--------------|
| 1 | Diflufenzopyr          | 1:12 – 96:1   | 1:4 – 32:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Dimethachlor           | 1:768 – 2:1   | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Dimethametryn          | 1:192 – 6:1   | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Dimethenamid-P         | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Dithiopyr              | 1:192 – 6:1   | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Diuron                 | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | EPTC                   | 1:768 – 2:1   | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Esprocarb              | 1:1371 – 1:2  | 1:457 – 1:4 | 1:171 – 1:20 |
| 1 | Ethalfuralin           | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Ethametsulfuron-methyl | 1:17 – 68:1   | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Ethoxyfen              | 1:8 – 135:1   | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Ethoxysulfuron         | 1:20 – 56:1   | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Etobenzanid            | 1:257 – 5:1   | 1:85 – 2:1  | 1:32 – 1:4   |
| 1 | Fenoxaprop-ethyl       | 1:120 – 10:1  | 1:40 – 4:1  | 1:15 – 1:2   |
| 1 | Fenoxasulfone          | 1:85 – 14:1   | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Fenquinotrione         | 1:17 – 68:1   | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Fentrazamide           | 1:17 – 68:1   | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Flazasulfuron          | 1:17 – 68:1   | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Florasulam             | 1:2 – 420:1   | 1:1 – 140:1 | 2:1 – 27:1   |
| 1 | Fluazifop-butyl        | 1:192 – 6:1   | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Flucarbazone           | 1:8 – 135:1   | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Flucetosulfuron        | 1:8 – 135:1   | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Flufenacet             | 1:257 – 5:1   | 1:85 – 2:1  | 1:32 – 1:4   |
| 1 | Flumetsulam            | 1:24 – 48:1   | 1:8 – 16:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Flumiclorac-pentyl     | 1:10 – 112:1  | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Flumioxazin            | 1:25 – 45:1   | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Fluometuron            | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Flupyrsulfuron-methyl  | 1:3 – 336:1   | 1:1 – 112:1 | 2:1 – 21:1   |
| 1 | Fluridone              | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Fluroxypyr             | 1:96 – 12:1   | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Flurtamone             | 1:857 – 2:1   | 1:285 – 1:3 | 1:107 – 1:12 |
| 1 | Fluthiacet-methyl      | 1:48 – 42:1   | 1:16 – 14:1 | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Fomesafen              | 1:96 – 12:1   | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Foramsulfuron          | 1:13 – 84:1   | 1:4 – 28:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Glufosinate            | 1:288 – 4:1   | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Glyphosate             | 1:288 – 4:1   | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Halosulfuron-methyl    | 1:17 – 68:1   | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Halauxifen             | 1:20 – 56:1   | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Halauxifen-methyl      | 1:20 – 56:1   | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Haloxypop-methyl       | 1:34 – 34:1   | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Hexazinone             | 1:192 – 6:1   | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Hydantocidin           | 1:1100 – 16:1 | 1:385 – 8:1 | 1:144 – 4:1  |
| 1 | Imazamox               | 1:13 – 84:1   | 1:4 – 28:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Imazapic               | 1:20 – 56:1   | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Imazapyr               | 1:85 – 14:1   | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Imazaquin              | 1:34 – 34:1   | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Imazethabenz-methyl    | 1:171 – 7:1   | 1:57 – 3:1  | 1:21 – 1:3   |
| 1 | Imazethapyr            | 1:24 – 48:1   | 1:8 – 16:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Imazosulfuron          | 1:27 – 42:1   | 1:9 – 14:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Indanofan              | 1:342 – 4:1   | 1:114 – 2:1 | 1:42 – 1:5   |
| 1 | Indaziflam             | 1:25 – 45:1   | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Iodosulfuron-methyl    | 1:3 – 336:1   | 1:1 – 112:1 | 2:1 – 21:1   |
| 1 | Ioxynil                | 1:192 – 6:1   | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Ipfencarbazone         | 1:85 – 14:1   | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Isoproturon            | 1:384 – 3:1   | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |

|   |                      |              |             |              |
|---|----------------------|--------------|-------------|--------------|
| 1 | Isoxaben             | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Isoxaflutole         | 1:60 – 20:1  | 1:20 – 7:1  | 1:7 – 2:1    |
| 1 | Lactofen             | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Lenacil              | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Linuron              | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | MCPA                 | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | MCPB                 | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Mecoprop             | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Mefenacet            | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Mefluidide           | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Mesosulfuron-methyl  | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Mesotrione           | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Metamifop            | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Metazachlor          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Metazosulfuron       | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Methabenzthiazuron   | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Metolachlor          | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Metosulam            | 1:8 – 135:1  | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Metribuzin           | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Metsulfuron-methyl   | 1:2 – 560:1  | 1:1 – 187:1 | 3:1 – 35:1   |
| 1 | Molinate             | 1:1028 – 2:1 | 1:342 – 1:3 | 1:128 – 1:15 |
| 1 | Napropamide          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Napropamide-M        | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Naptalam             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Nicosulfuron         | 1:12 – 96:1  | 1:4 – 32:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Norflurazon          | 1:1152 – 1:1 | 1:384 – 1:3 | 1:144 – 1:16 |
| 1 | Orbencarb            | 1:1371 – 1:2 | 1:457 – 1:4 | 1:171 – 1:20 |
| 1 | Orthosulfamuron      | 1:20 – 56:1  | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Oryzalin             | 1:514 – 3:1  | 1:171 – 1:2 | 1:64 – 1:8   |
| 1 | Oxadiargyl           | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Oxadiazon            | 1:548 – 3:1  | 1:182 – 1:2 | 1:68 – 1:8   |
| 1 | Oxasulfuron          | 1:27 – 42:1  | 1:9 – 14:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Oxaziclomefone       | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Oxyfluorfen          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Paraquat             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Pendimethalin        | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Penoxsulam           | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Pentoxamid           | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Pentoxazone          | 1:102 – 12:1 | 1:34 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Phenmedipham         | 1:102 – 12:1 | 1:34 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Picloram             | 1:96 – 12:1  | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Picolinafen          | 1:34 – 34:1  | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Pinoxaden            | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Pretilachlor         | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Primisulfuron-methyl | 1:8 – 135:1  | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Prodiamine           | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Profoxydim           | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Prometryn            | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Propachlor           | 1:1152 – 1:1 | 1:384 – 1:3 | 1:144 – 1:16 |
| 1 | Propanil             | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Propaquizafop        | 1:48 – 24:1  | 1:16 – 8:1  | 1:6 – 2:1    |
| 1 | Propoxycarbazone     | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Propyrisulfuron      | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Propyzamide          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Prosulfocarb         | 1:1200 – 1:2 | 1:400 – 1:4 | 1:150 – 1:17 |

|   |                       |              |             |              |
|---|-----------------------|--------------|-------------|--------------|
| 1 | Prosulfuron           | 1:6 – 168:1  | 1:2 – 56:1  | 1:1 – 11:1   |
| 1 | Pyraclonil            | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Pyraflufen-ethyl      | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Pyrasulfotole         | 1:13 – 84:1  | 1:4 – 28:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Pyrazolynate          | 1:857 – 2:1  | 1:285 – 1:3 | 1:107 – 1:12 |
| 1 | Pyrazosulfuron-ethyl  | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Pyrazoxyfen           | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Pyribenzoxim          | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Pyributicarb          | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Pyridate              | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Pyriftalid            | 1:10 – 112:1 | 1:3 – 38:1  | 1:1 – 7:1    |
| 1 | Pyriminobac-methyl    | 1:20 – 56:1  | 1:6 – 19:1  | 1:2 – 4:1    |
| 1 | Pyrimisulfan          | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Pyriothiac            | 1:24 – 48:1  | 1:8 – 16:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Pyroxasulfone         | 1:85 – 14:1  | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Pyroxulam             | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Quinclorac            | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Quizalofop-ethyl      | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Rimsulfuron           | 1:13 – 84:1  | 1:4 – 28:1  | 1:1 – 6:1    |
| 1 | Saflufenacil          | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Sethoxydim            | 1:96 – 12:1  | 1:32 – 4:1  | 1:12 – 1:2   |
| 1 | Simazine              | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Sulcotrione           | 1:120 – 10:1 | 1:40 – 4:1  | 1:15 – 1:2   |
| 1 | Sulfentrazone         | 1:147 – 8:1  | 1:49 – 3:1  | 1:18 – 1:3   |
| 1 | Sulfometuron-methyl   | 1:34 – 34:1  | 1:11 – 12:1 | 1:4 – 3:1    |
| 1 | Sulfosulfuron         | 1:8 – 135:1  | 1:2 – 45:1  | 1:1 – 9:1    |
| 1 | Tebuthiuron           | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Tefuryltrione         | 1:42 – 27:1  | 1:14 – 9:1  | 1:5 – 2:1    |
| 1 | Tembotrione           | 1:31 – 37:1  | 1:10 – 13:1 | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Tepraloxym            | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Terbacil              | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Terbutylazine         | 1:857 – 2:1  | 1:285 – 1:3 | 1:107 – 1:12 |
| 1 | Terbutryn             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Thenylchlor           | 1:85 – 14:1  | 1:28 – 5:1  | 1:10 – 1:2   |
| 1 | Thiazopyr             | 1:384 – 3:1  | 1:128 – 1:1 | 1:48 – 1:6   |
| 1 | Thiencarbazone        | 1:3 – 336:1  | 1:1 – 112:1 | 2:1 – 21:1   |
| 1 | Thifensulfuron-methyl | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Tiafenacil            | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Thiobencarb           | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Tolpyralate           | 1:31 – 37:1  | 1:10 – 13:1 | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Topramzone            | 1:6 – 168:1  | 1:2 – 56:1  | 1:1 – 11:1   |
| 1 | Tralkoxydim           | 1:68 – 17:1  | 1:22 – 6:1  | 1:8 – 2:1    |
| 1 | Triafamone            | 1:2 – 420:1  | 1:1 – 140:1 | 2:1 – 27:1   |
| 1 | Triallate             | 1:768 – 2:1  | 1:256 – 1:2 | 1:96 – 1:11  |
| 1 | Triasulfuron          | 1:5 – 224:1  | 1:1 – 75:1  | 1:1 – 14:1   |
| 1 | Triaziflam            | 1:171 – 7:1  | 1:57 – 3:1  | 1:21 – 1:3   |
| 1 | Tribenuron-methyl     | 1:3 – 336:1  | 1:1 – 112:1 | 2:1 – 21:1   |
| 1 | Triclopyr             | 1:192 – 6:1  | 1:64 – 2:1  | 1:24 – 1:3   |
| 1 | Trifloxysulfuron      | 1:2 – 420:1  | 1:1 – 140:1 | 2:1 – 27:1   |
| 1 | Trifludimoxazin       | 1:25 – 45:1  | 1:8 – 15:1  | 1:3 – 3:1    |
| 1 | Trifluralin           | 1:288 – 4:1  | 1:96 – 2:1  | 1:36 – 1:4   |
| 1 | Triflusulfuron-methyl | 1:17 – 68:1  | 1:5 – 23:1  | 1:2 – 5:1    |
| 1 | Tritosulfuron         | 1:13 – 84:1  | 1:4 – 28:1  | 1:1 – 6:1    |

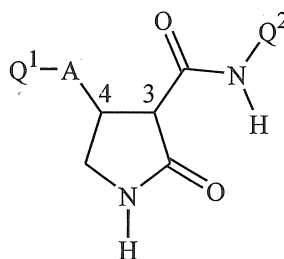
Bảng A2 được cấu trúc giống như Bảng A1 nêu trên chỉ khác là các mục nằm dưới đề mục của cột “Thành phần (a)” được thay thế bằng mục cột Thành phần (a) tương ứng được thể hiện dưới đây. Hợp chất 2 trong cột Thành phần (a) được xác định trong Bảng chỉ số A. Do vậy, ví dụ, trong Bảng A2 các mục nằm dưới đề mục của cột “Thành phần (a)” đều để chỉ “Hợp chất 2” (tức là Hợp chất 79 được xác định trong Bảng chỉ số A), và dòng thứ nhất của các đề mục của cột trong Bảng A2 dưới đây đề cập một cách rõ ràng hỗn hợp chứa Hợp chất 2 với 2,4-D. Các Bảng A3 đến A35 được cấu trúc theo cách tương tự.

| <u>Bảng số</u> | <u>Mục nhập của cột Thành phần (a)</u> | <u>Bảng số</u> | <u>Mục nhập của cột Thành phần (a)</u> |
|----------------|----------------------------------------|----------------|----------------------------------------|
| A2             | Hợp chất 792                           | A19            | Hợp chất 31519                         |
| A3             | Hợp chất 803                           | A20            | Hợp chất 31920                         |
| A4             | Hợp chất 54                            | A21            | Hợp chất 32321                         |
| A5             | Hợp chất 35                            | A22            | Hợp chất 35122                         |
| A6             | Hợp chất 56                            | A23            | Hợp chất 23                            |
| A7             | Hợp chất 807                           | A24            | Hợp chất 24                            |
| A8             | Hợp chất 1018                          | A25            | Hợp chất 25                            |
| A9             | Hợp chất 1039                          | A26            | Hợp chất 26                            |
| A10            | Hợp chất 15610                         | A27            | Hợp chất 27                            |
| A11            | Hợp chất 20211                         | A28            | Hợp chất 28                            |
| A12            | Hợp chất 20412                         | A29            | Hợp chất 29                            |
| A13            | Hợp chất 20613                         | A30            | Hợp chất 30                            |
| A14            | Hợp chất 23214                         | A31            | Hợp chất 31                            |
| A15            | Hợp chất 26315                         | A32            | Hợp chất 32                            |
| A16            | Hợp chất 27116                         | A33            | Hợp chất 33                            |
| A17            | Hợp chất 30417                         | A34            | Hợp chất 34                            |
| A18            | Hợp chất 30618                         | A35            | Hợp chất 35                            |

Tốt hơn là, để phòng trừ tốt hơn thực vật không mong muốn (ví dụ, tỷ lệ sử dụng thấp hơn như từ hiệu quả hiệp đồng, phổ phòng trừ cỏ dại rộng hơn, hoặc mức an toàn cây trồng tốt hơn) hoặc để ngăn ngừa sự phát triển cỏ dại có tính kháng là hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế với thuốc diệt cỏ được chọn từ nhóm bao gồm clorimuron-etyl, nicosulfuron, mesotrion, thifensulfuron-metyl, flupyrsulfuron-metyl, tribenuron, pyroxasulfon, pinoxaden, tembotrion, pyroxsulam, metolaclo và S-metolaclo.

Các thử nghiệm dưới đây chứng minh hiệu quả phòng trừ của hợp chất theo sáng chế đối với các loài cỏ cụ thể. Tuy nhiên, việc bảo vệ bằng cách phòng trừ cỏ đạt được bằng các hợp chất không bị giới hạn ở các loài này. Xem Bảng chỉ số A về phần mô tả hợp chất. Các từ viết tắt được sử dụng trong Bảng chỉ số là như sau: Ph là phenyl. Từ viết tắt “Cmpd. No.” đại diện cho “Hợp chất số”. Từ viết tắt “Ex.” đại diện cho “Ví dụ” và tiếp theo là số chỉ hợp chất ví dụ được điều chế. Phổ khối được báo cáo với độ chính xác ước lượng trong khoảng  $\pm 0,5$  Da dưới dạng phân tử lượng của ion gốc có nhiều đồng vị nhất (M+1) được tạo ra bằng cách bổ sung  $H^+$  (phân tử lượng bằng 1) vào phân tử này, quan sát được bằng cách sử dụng phương pháp ion hóa bằng hóa học tại áp suất khí quyển ( $AP^+$ ). Như mô tả dưới đây đối với biến số A, liên kết phân nhánh về phía bên trái được nối với gốc  $Q^1$ , và liên kết phân nhánh về phía bên phải được nối với phần còn lại của công thức 1.

Bảng chỉ số A



| Hợp chất số  | $Q^1$                  | $Q^2$                  | A                                         | m.p. (°C) | M-1 | M+1 |
|--------------|------------------------|------------------------|-------------------------------------------|-----------|-----|-----|
| 1            | Ph(3-Cl)               | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 132-134   |     |     |
| 2            | Ph(3-Cl)               | Ph(2-F)                | -CH <sub>2</sub> -                        | 122-125   |     |     |
| 3            | Ph                     | Ph(2-F)                | -CH <sub>2</sub> -                        | 132-135   |     |     |
| 4            | Ph                     | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 182-185   |     |     |
| 5            | Ph(2-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2-CF <sub>3</sub> ) | -CH <sub>2</sub> -                        |           | 429 | 431 |
| 6            | Ph(4-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2-CF <sub>3</sub> ) | -CH <sub>2</sub> -                        | 136-139   |     |     |
| 7            | Ph(4-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 198-201   |     |     |
| 8            | Ph(2,3-di-F)           | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 149-153   |     |     |
| 9            | Ph(2-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 173-177   |     |     |
| 10           | Ph(2,3-di-F)           | Ph(2-CF <sub>3</sub> ) | -CH <sub>2</sub> -                        | 131-135   |     |     |
| 11           | Ph(3-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 179-182   |     |     |
| 12           | Ph(3,4-di-F)           | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 162-168   |     |     |
| 13 (Ví dụ 1) | Ph(4-F)                | Ph(2,3-di-F)           | -CH <sub>2</sub> -                        | 173-176   |     |     |
| 14           | Ph(4-F)                | Ph(2-F)                | -CH <sub>2</sub> -                        | 135-138   |     |     |
| 15           | Ph(4-F)                | Ph(2-F)                | -NHC(=O)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |           | 386 | 388 |
| 16           | Ph(4-F)                | Ph(2,3-di-F)           | -C≡C-                                     | 185-188   |     |     |

| Hợp chất số  | Q <sup>1</sup>         | Q <sup>2</sup>  | A                                  | m.p. (°C) | M-1 | M+1 |
|--------------|------------------------|-----------------|------------------------------------|-----------|-----|-----|
| 17           | Ph(4-F)                | Ph(2,3,4-tri-F) | -C□C-                              | 186-189   |     |     |
| 18           | Ph(3-CF <sub>3</sub> ) | Ph(2,3-di-F)    | -NHC(=O)-                          |           | 426 | 428 |
| 19           | Ph(4-F)                | Ph(2-F)         | -C□C-                              | 184-187   |     |     |
| 20           | Ph                     | Ph(2-F)         | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | 141-144   |     |     |
| 21           | Ph(3-CH <sub>3</sub> ) | Ph(2-F)         | -C□C-                              | 123-127   |     |     |
| 22           | Ph(3-CH <sub>3</sub> ) | Ph(2,3-di-F)    | -C□C-                              | 155-157   |     |     |
| 23           | Ph(3-CH <sub>3</sub> ) | Ph(2,3,4-tri-F) | -C□C-                              | 172-176   |     |     |
| 24           | Ph(3-F)                | Ph(2-F)         | -HC□CH- *                          | 168-172   |     |     |
| 25 (Ví dụ 4) | Ph(3-Cl)               | Ph(2,3-di-F)    | -C□C-                              | 154-156   |     |     |
| 26           | Ph(3-Cl)               | Ph(2,3,4-tri-F) | -C□C-                              | 178-182   |     |     |
| 27           | Ph(4-F)                | Ph(2-F)         | -HC□CH- *                          | 160-163   |     |     |
| 28           | Ph(2-F)                | Ph(2,3-di-F)    | -HC□CH- *                          | 204-206   |     |     |
| 29           | Ph(3-Cl)               | Ph(2-F)         | -C□C-                              | 120-124   |     |     |
| 30           | Ph(3-F)                | Ph(2,3-di-F)    | -HC□CH- *                          | 181-185   |     |     |
| 31           | Ph(4-F)                | Ph(2,3-di-F)    | -HC□CH- *                          | 194-197   |     |     |
| 32           | Ph                     | Ph(2-F)         | -HC□CH- *                          | 160-164   |     |     |
| 33 (Ví dụ 2) | Ph                     | Ph(2,3-di-F)    | -HC□CH- *                          | 200-204   |     |     |
| 34           | Ph(2-F)                | Ph(2-F)         | -HC□CH- *                          | 161-164   |     |     |
| 35 (Ví dụ 3) | Ph                     | Ph(2,3-di-F)    | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | 142-145   |     |     |

\* điều chế được dưới dạng chất đồng phân *E*

#### Thử nghiệm sinh học

##### Thử nghiệm A

Hạt của loài thực vật được chọn từ cỏ lồng vực (*Echinocloa crus-galli*), cỏ cua (cỏ cua lớn, *Digitaria sanguinalis*), địa phu tử (Cây vắn vương scoparia), cỏ phấn hương (cỏ phấn hương thường, *Ambrosia elatior*), ryegrass, Italian (Italian ryegrass, *Lolium multiflorum*), crabgrass, large (large crabgrass *Digitaria sanguinalis*), giant foxtail (*Setaria faberii*), cây bìm bìm hoa tím (*Ipomoea* spp.), pigweed (*Amaranthus retroflexus*), cây cối xay (*Abutilon theophrasti*), cỏ mạch đen (cỏ mạch đen Ý, *Lolium multiflorum*), cỏ đuôi cáo (cỏ đuôi cáo không lồ, *Setaria faberii*), cây lúa mì (*Triticum aestivum*), and cây ngô (*Zea mays*), và rau dền (*Amaranthus retroflexus*), được trồng vào hỗn hợp đất mùn và cát và được xử lý ở giai đoạn trước nảy mầm bằng cách phun trực tiếp vào đất sử dụng các hóa chất thử nghiệm được điều chế trong hỗn hợp dung môi không gây độc thực vật mà có chứa chất hoạt động bề mặt.

Đồng thời, thực vật được chọn từ các loài cây trồng và cỏ dại này và cả cỏ đen (*Alopecurus myosuroides*), và cây đông sữa (cây vắn vương, *Cây đông sữa aparine*) được trồng trong chậu chứa cùng hỗn hợp đất mùn và cát và được xử lý ở giai đoạn sau nảy mầm bằng cách phun các hóa chất thử nghiệm được điều chế theo cùng cách. Các thực vật có độ cao nằm trong khoảng từ 2 đến 10 cm và ở giai đoạn một lá đến hai lá để xử lý ở giai đoạn sau nảy mầm. Thực vật đã được xử lý và thực vật kiểm chứng không được xử lý được duy trì trong nhà kính trong khoảng 10 ngày, sau thời gian đó tất cả các thực vật đã xử lý được so sánh với mẫu kiểm chứng không được xử lý và được đánh giá bằng trực quan về mức độ tổn thương. Tỷ lệ đáp ứng của thực vật, được tóm tắt trong Bảng A, được tính theo thang đo từ 0 đến 100 trong đó 0 là không có tác dụng diệt cỏ và 100 là phòng trừ cỏ dại hoàn toàn. Nét (–) nghĩa là không có kết quả thử nghiệm.

## Bảng A Hợp chất

|                      |                  |
|----------------------|------------------|
| 1000g hoạt chất/ha   | 1 2 3 4 13 14    |
| Sau nảy mầm          |                  |
| Cỏ lồng vực          | 80 30 0 0 80 0   |
| Ngô                  | 0 0 0 0 0 0      |
| Cỏ cua               | 80 80 0 20 80 20 |
| Cỏ đuôi cáo không lờ | 80 60 0 0 60 0   |
| Cây bìm bìm hoa tím  | 0 0 0 0 0 0      |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0      |
| Cây cối xay          | 10 0 0 0 0 0     |
| Cây lúa mỳ           | 0 0 0 0 0 0      |

## Bảng A Hợp chất

|                      |                                      |
|----------------------|--------------------------------------|
| 500g hoạt chất/ha    | 5 6 7 8 9 10 11 12 15 16 17 18 19 20 |
| Sau nảy mầm          |                                      |
| Cỏ lồng vực          | 0 0 60 0 60 0 0 0 0 60 90 30 40 0    |
| Cây cỏ đen           | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 30 0 0         |
| Ngô                  | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |
| Cỏ đuôi cáo không lờ | 0 0 20 0 0 0 0 0 0 40 50 50 20 0     |
| Cây đồng sữa         | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 50 0 0         |
| Cây vắn vương        | 0 0 0 0 30 0 0 0 0 0 0 0 0 0         |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 30 0 0         |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |
| Cỏ mạch đen          | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |
| Cây lúa mỳ           | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |

## Bảng A Hợp chất

|                      |                                              |
|----------------------|----------------------------------------------|
| 500g hoạt chất/ha    | 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 |
| Sau nảy mầm          |                                              |
| Cỏ lồng vực          | 50 70 50 70 70 60 60 70 60 80 70 90 90 60 30 |
| Cây cỏ đen           | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0                |
| Ngô                  | 0 20 0 0 0 0 0 0 0 20 20 20 0 0 0            |
| Cỏ đuôi cáo không lờ | 20 50 50 80 80 40 70 50 60 80 60 80 70 80 30 |
| Cây đồng sữa         | 0 20 20 0 60 0 0 20 0 20 30 0 0 0 0          |
| Cây vắn vương        | 0 0 20 - 0 0 - 0 0 0 30 0 0 0 0              |
| Rau dền              | 0 0 0 0 20 0 20 0 0 0 0 0 0 0 0              |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 10 10 0 0             |

|             |                                   |
|-------------|-----------------------------------|
| Cỏ mạch đen | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 0 0    |
| Cây lúa mì  | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 0 20 0 |

## Bảng A Hợp chất

|                   |                                      |
|-------------------|--------------------------------------|
| 125g hoạt chất/ha | 5 6 7 8 9 10 11 12 15 16 17 18 19 20 |
|-------------------|--------------------------------------|

Sau nảy mầm

|             |                                 |
|-------------|---------------------------------|
| Cỏ lồng vực | 0 0 0 0 10 0 0 0 0 40 20 20 0 0 |
|-------------|---------------------------------|

|            |                              |
|------------|------------------------------|
| Cây cỏ đen | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 |
|------------|------------------------------|

|     |                             |
|-----|-----------------------------|
| Ngô | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|-----|-----------------------------|

|                      |                               |
|----------------------|-------------------------------|
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 20 0 0 |
|----------------------|-------------------------------|

|              |                             |
|--------------|-----------------------------|
| Cây đồng sữa | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|--------------|-----------------------------|

|               |                             |
|---------------|-----------------------------|
| Cây vắn vương | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|---------------|-----------------------------|

|         |                             |
|---------|-----------------------------|
| Rau dền | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|---------|-----------------------------|

|               |                             |
|---------------|-----------------------------|
| Cỏ phấn hương | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|---------------|-----------------------------|

|             |                             |
|-------------|-----------------------------|
| Cỏ mạch đen | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|-------------|-----------------------------|

|            |                             |
|------------|-----------------------------|
| Cây lúa mì | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|------------|-----------------------------|

## Bảng A Hợp chất

|                   |                                              |
|-------------------|----------------------------------------------|
| 125g hoạt chất/ha | 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 |
|-------------------|----------------------------------------------|

Sau nảy mầm

|             |                                       |
|-------------|---------------------------------------|
| Cỏ lồng vực | 0 40 20 0 40 0 0 50 0 50 30 40 50 0 0 |
|-------------|---------------------------------------|

|            |                             |
|------------|-----------------------------|
| Cây cỏ đen | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|------------|-----------------------------|

|     |                                |
|-----|--------------------------------|
| Ngô | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 0 |
|-----|--------------------------------|

|                      |                                         |
|----------------------|-----------------------------------------|
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 20 20 30 30 0 0 20 0 40 30 20 70 20 0 |
|----------------------|-----------------------------------------|

|              |                             |
|--------------|-----------------------------|
| Cây đồng sữa | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|--------------|-----------------------------|

|               |                             |
|---------------|-----------------------------|
| Cây vắn vương | 0 0 0 - 0 0 - 0 0 0 0 0 0 0 |
|---------------|-----------------------------|

|         |                             |
|---------|-----------------------------|
| Rau dền | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|---------|-----------------------------|

|               |                                 |
|---------------|---------------------------------|
| Cỏ phấn hương | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 10 10 0 0 |
|---------------|---------------------------------|

|             |                             |
|-------------|-----------------------------|
| Cỏ mạch đen | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|-------------|-----------------------------|

|            |                             |
|------------|-----------------------------|
| Cây lúa mì | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 |
|------------|-----------------------------|

## Bảng A Hợp chất

|                    |               |
|--------------------|---------------|
| 1000g hoạt chất/ha | 1 2 3 4 13 14 |
|--------------------|---------------|

Trước nảy mầm

|             |                 |
|-------------|-----------------|
| Cỏ lồng vực | 70 30 0 0 80 20 |
|-------------|-----------------|

|     |             |
|-----|-------------|
| Ngô | 0 0 0 0 0 0 |
|-----|-------------|

|        |                  |
|--------|------------------|
| Cỏ cua | 90 90 0 60 80 80 |
|--------|------------------|

|                      |                 |
|----------------------|-----------------|
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 90 80 0 0 60 30 |
|----------------------|-----------------|

|                      |                                              |
|----------------------|----------------------------------------------|
| Cây bìm bìm hoa tím  | 0 0 0 0 0 0                                  |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0                                  |
| Cây cối xay          | 0 0 0 0 0 0                                  |
| Cây lúa mỳ           | 0 0 0 0 0 0                                  |
| Bảng A Hợp chất      |                                              |
| 500g hoạt chất/ha    | 5 6 7 8 9 10 11 12 15 16 17 18 19 20         |
| Trước nảy mầm        |                                              |
| Cỏ lồng vực          | 0 0 40 0 50 0 0 60 0 90 50 30 50 0           |
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 0 30 50 50 0 0 60 0 90 90 60 20 0          |
| Cây vắn vương        | 0 0 0 0 50 0 0 0 0 0 0 0 0 0                 |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0 0                 |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 0 30 0 0 0 0 0 0 - 0 0                 |
| Cỏ mạch đen          | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 0 0                 |
| Bảng A Hợp chất      |                                              |
| 500g hoạt chất/ha    | 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 |
| Trước nảy mầm        |                                              |
| Cỏ lồng vực          | 80 80 80 70 90 70 50 90 70 90 70 60 90 80 30 |
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 70 80 90 90 70 60 90 60 90 70 80 90 80 60  |
| Cây vắn vương        | 0 20 0 20 60 0 40 0 0 80 20 0 20 0 50        |
| Rau dền              | 0 0 0 0 50 40 0 0 0 0 0 0 0 100 0            |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 30 0 0 30 0 0 0 0 0 0 0 0              |
| Cỏ mạch đen          | 20 0 0 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 0 0              |
| Bảng A Hợp chất      |                                              |
| 125g hoạt chất/ha    | 5 6 7 8 9 10 11 12 15 16 17 18 19 20         |
| Trước nảy mầm        |                                              |
| Cỏ lồng vực          | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 20 20 20 0 0               |
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 60 30 50 0 0               |
| Cây vắn vương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0                  |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0                  |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0                  |
| Cỏ mạch đen          | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0                  |
| Bảng A Hợp chất      |                                              |
| 125g hoạt chất/ha    | 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 |
| Trước nảy mầm        |                                              |
| Cỏ lồng vực          | 20 60 60 30 60 0 0 50 30 50 0 20 50 20 0     |

|                      |                                        |
|----------------------|----------------------------------------|
| Cỏ đuôi cáo khổng lồ | 0 50 40 60 40 0 0 50 0 60 20 0 50 20 0 |
| Cây vắn vương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 70 0 0 0 0 0         |
| Rau dền              | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 80 0         |
| Cỏ phấn hương        | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |
| Cỏ mạch đen          | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0          |

### Thử nghiệm B

Các cây trồng trong thử nghiệm ngập nước được chọn từ cây lúa (*Oryza sativa*), cây lách, cây cháo (cỏ cháo hoa nhỏ, *Cyperus difformis*), cỏ lười vệt (*Heteranthera limosa*), và cỏ lồng vực (*Echinochloa crus-galli*) được để sinh trưởng đến giai đoạn 2 lá để thử nghiệm. Vào thời điểm xử lý, các chậu thử nghiệm được cho ngập đến 3 cm trên bề mặt của đất, được xử lý bằng cách phun các hợp chất thử nghiệm trực tiếp lên nước ngập, và sau đó duy trì ở độ sâu nước đó trong quá trình thử nghiệm. Cây xử lý và cây kiểm chứng được duy trì trong nhà kính trong 13 đến 15 ngày, sau thời gian đó tất cả các loài được so sánh với mẫu kiểm chứng và được đánh giá bằng trực quan. Các đánh giá mức đáp ứng của cây trồng, được tóm tắt trong Bảng B, trên cơ sở thang đo từ 0 đến 100 trong đó 0 là không có hiệu quả và 100 là phòng trừ hoàn toàn. Nét (–) nghĩa là không có kết quả thử nghiệm.

#### Bảng B Hợp chất

1000g hoạt chất/ha 1 2

Ngập nước

Cỏ lồng vực 0 0

Cỏ lười vệt 50 0

Cây lúa 0 0

Cỏ cháo 0 0

#### Bảng B Hợp chất

250g hoạt chất/ha 13

Ngập nước

Cỏ lồng vực 0

Cỏ lười vệt 0

Cây lúa 0

Cỏ cháo 0

#### Bảng B Hợp chất

500g hoạt chất/ha 5 6 7 8 9 10 11 12 15

Ngập nước

Cỏ lồng vực 0 0 25 0 0 0 0 0 0

Cỏ lười vệt 0 0 75 0 40 0 0 0 70

Cây lúa 0 0 0 0 0 0 0 0 0

Cỏ cháo 0 0 0 0 0 0 0 0 0

#### Bảng B Hợp chất

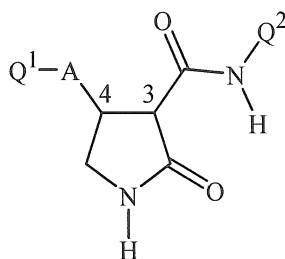
250g hoạt chất/ha 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28

Ngập nước

Cỏ lồng vực 0 0 30 0 0 0 0 0 70 0 0 0 90

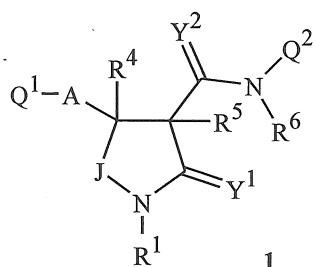
|                    |                              |
|--------------------|------------------------------|
| Cây lúa            | 0 0 15 0 0 0 0 0 0 20 0 0 10 |
| Cỏ cháo            | 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 50   |
| Bảng B    Hợp chất |                              |
| 250g hoạt chất/ha  | 29 30 31 32 33 34 35         |
| Ngập nước          |                              |
| Cỏ lồng vực        | 0 70 40 0 40 0 0             |
| Cỏ lưỡi vịt        | 75 95 80 70 95 80 70         |
| Cây lúa            | 0 15 15 0 0 15 0             |
| Cỏ cháo            | 0 0 50 0 0 60 0              |

Chỉ số bảng A



## Yêu cầu bảo hộ

1. Hợp chất được chọn từ công thức 1, N oxit và muối của nó,



trong đó

A là mạch bão hòa, chưa bão hòa một phần hoặc chưa bão hòa hoàn toàn chứa 1 đến 3 nguyên tử được chọn từ tối đa 3 nguyên tử cacbon tối đa 1 nguyên tử O, tối đa 1 nguyên tử S và tối đa 2 nguyên tử N, trong đó: tối đa 2 thành phần cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và thành phần nguyên tử lưu huỳnh được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>; mạch nói trên tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>15</sup> trên nguyên tử cacbon và R<sup>16</sup> trên nguyên tử nitơ;

Q<sup>1</sup> là vòng phenyl hoặc hệ vòng naphtalenyl, mỗi vòng hoặc hệ vòng tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup>; hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có từ 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ carbon nguyên tử và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, trong đó tối đa 3 thành phần cacbon trong vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và các thành phần nguyên tử lưu huỳnh trong vòng độc lập được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, mỗi vòng hoặc hệ vòng tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>7</sup> trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ R<sup>9</sup> trên các thành phần nguyên tử nitơ trong vòng;

Q<sup>2</sup> là vòng phenyl hoặc hệ vòng naphtalenyl, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>10</sup>; hoặc nhân dị vòng thơm có 5 đến 6 cạnh hoặc hệ vòng hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này là các thành phần vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, trong đó tối đa 3 thành phần vòng là nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và thành phần vòng là nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>8</sup>)<sub>v</sub>, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ R<sup>10</sup> trên các thành phần vòng là nguyên tử cacbon và được chọn từ R<sup>11</sup> trên các thành phần vòng là nguyên tử nitơ;

mỗi  $Y^1$  và  $Y^2$  độc lập là nguyên tử O, S hoặc  $NR^{12}$ ;

J là  $-CR^2R^3-$ ; hoặc  $-CR^2R^3-CR^{2a}R^{3a}-$ , trong đó: nhóm  $-CR^2R^3-$  được liên kết trực tiếp với N;

$R^1$  là H, hydroxy, amino, xyano, formyl,  $C_3-C_8$  alkylcarbonylalkyl,  $-C(C_1-C_4 \text{ alkyl})=N-O(C_1-C_4 \text{ alkyl})$ ,  $-C(O)NH_2$ ,  $C_1-C_6$  alkyl,  $C_1-C_6$  haloalkyl,  $C_2-C_6$  alkenyl,  $C_3-C_6$  alkynyl,  $C_2-C_6$  xyanoalkyl,  $C_3-C_6$  xycloalkyl,  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_2-C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3-C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  haloalkenylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkylcarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkylcarbonyl,  $C_5-C_{10}$  xycloalkylcarbonylalkyl,  $C_2-C_8$  alkoxycarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxycarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkoxycarbonyl,  $C_2-C_8$  alkylaminoalkyl,  $C_2-C_8$  alkylaminocarbonyl,  $C_3-C_{10}$  dialkylaminocarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkylaminocarbonyl,  $C_1-C_6$  alkoxy,  $C_1-C_6$  alkylthio,  $C_1-C_6$  haloalkylthio,  $C_3-C_8$  xycloalkylthio,  $C_1-C_6$  alkylsulfinyl,  $C_1-C_6$  haloalkylsulfinyl,  $C_3-C_8$  xycloalkylsulfinyl,  $C_1-C_6$  alkylsulfonyl,  $C_1-C_6$  haloalkylsulfonyl,  $C_3-C_8$  xycloalkylsulfonyl,  $C_1-C_6$  alkylaminosulfonyl,  $C_2-C_8$  dialkylaminosulfonyl,  $C_3-C_{10}$  trialkylsilyl; hoặc arylcarbonyl, arylalkenylalkyl, arylcarbonylalkyl hoặc  $-CPh=N-O(C_1-C_4 \text{ alkyl})$ , mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{13}$ ; hoặc  $G^1$ ;

mỗi  $R^2$  và  $R^3$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl hoặc  $C_1-C_4$  alkoxy; hoặc

$R^2$  và  $R^3$  cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo ra vòng  $C_3-C_7$  xycloalkyl;

mỗi  $R^{2a}$  và  $R^{3a}$  độc lập là H, halogen hoặc  $C_1-C_4$  alkyl; hoặc

$R^{2a}$  và  $R^{3a}$  cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo ra vòng  $C_3-C_7$  xycloalkyl;

mỗi  $R^4$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1-C_4$  alkoxy hoặc  $C_1-C_4$  alkyl;

mỗi  $R^5$  độc lập là H, halogen, hydroxy,  $C_1-C_4$  alkoxy, xyano hoặc  $C_1-C_4$  alkyl;

$R^6$  là H, hydroxy, amino,  $C_1-C_6$  alkyl,  $C_1-C_6$  haloalkyl,  $C_2-C_6$  alkenyl,  $C_3-C_6$  alkynyl,  $C_2-C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3-C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkylcarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  alkoxycarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxycarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkoxycarbonyl,  $C_2-C_8$

alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi R<sup>7</sup> độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> alkylxycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> dialkylamino, formylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alkylcarbonylamino, -SF<sub>5</sub>, -SCN, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkoxy, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyhaloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; hoặc G<sup>2</sup>; hoặc R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NO-, (R<sup>19</sup>)<sub>2</sub>NN=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NNR<sup>20a</sup>-, R<sup>20</sup>N=CR<sup>17a</sup>-, (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=N-, R<sup>17</sup>ON=CR<sup>17a</sup>C(R<sup>23b</sup>)<sub>2</sub>- hoặc (R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>C=NOC(R<sup>24a</sup>)<sub>2</sub>-, trong đó liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết với Q<sup>1</sup>; hoặc hai R<sup>7</sup> liên kề cùng với nguyên tử cacbon mà chúng liên kết vào tạo thành vòng C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> xycloalkyl;

mỗi  $R^{10}$  độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro,  $C_1$ – $C_8$  alkyl,  $C_2$ – $C_8$  xyanoalkyl,  $C_1$ – $C_8$  xyanoalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkenyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkynyl,  $C_1$ – $C_8$  nitroalkyl,  $C_2$ – $C_8$  nitroalkenyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkyl,  $C_4$ – $C_{10}$  alkylxycloalkyl,  $C_1$ – $C_8$  alkoxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  alkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyloxy,  $C_3$ – $C_8$  alkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  haloalkynyloxy,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkoxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylthio,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylthio,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $C_1$ – $C_4$  alkylamino,  $C_2$ – $C_4$  dialkylamino, formylamino,  $C_2$ – $C_4$  alkylcarbonylamino,  $-SF_5$ ,  $-SCN$ ,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkoxy,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkenyloxy,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyloxy,  $C_1$ – $C_8$  alkylthio,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylthio,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylthio,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_8$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkylsulfonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkynyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkoxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyhaloalkyl,  $C_1$ – $C_8$  haloalkyl,  $C_3$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyloxy,  $C_2$ – $C_8$  haloalkylcarbonyloxy,  $C_3$ – $C_{12}$  trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; hoặc  $G^2$ ; hoặc  $R^{17}ON=CR^{17a}$ –,  $(R^{18})_2C=NO$ –,  $(R^{19})_2NN=CR^{17a}$ –,  $(R^{18})_2C=NNR^{20a}$ –,  $R^{20}N=CR^{17a}$ –,  $(R^{18})_2C=N$ –,  $R^{17}ON=CR^{17a}C(R^{23b})_2$ – hoặc  $(R^{18})_2C=NOC(R^{24a})_2$ –, trong đó liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết với  $Q^2$ ; hoặc hai liên kết  $R^{10}$  cùng với nguyên tử cacbon mà chúng liên kết vào tạo thành vòng  $C_3$ – $C_7$  xycloalkyl;

mỗi  $R^8$  độc lập là H, xyano,  $C_2$ – $C_3$  alkylcarbonyl hoặc  $C_2$ – $C_3$  haloalkylcarbonyl;

mỗi  $R^9$  và  $R^{11}$  độc lập là xyano,  $C_1$ – $C_3$  alkyl,  $C_2$ – $C_3$  alkenyl,  $C_2$ – $C_3$  alkynyl,  $C_3$ – $C_6$  xycloalkyl,  $C_2$ – $C_3$  alkoxyalkyl,  $C_1$ – $C_3$  alkoxy,  $C_2$ – $C_3$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_3$  alkoxycarbonyl,  $C_2$ – $C_3$  alkylaminoalkyl hoặc  $C_3$ – $C_4$  dialkylaminoalkyl;

mỗi  $R^{12}$  độc lập là H, xyano,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl,  $C_1-C_4$  alkoxy,  $C_1-C_4$  haloalkoxy,  $-(C=O)CH_3$  hoặc  $-(C=O)CF_3$ ;

mỗi  $G^1$  độc lập là phenyl, phenylmetyl, pyridinylmetyl, phenylcarbonyl, phenoxy, phenyletynyl, phenylsulfonyl, phenylcarbonylalkyl, 2-, 3- hoặc 4-pyridinyloxy hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{13}$ ;

mỗi  $G^2$  độc lập là phenyl, phenylmetyl, pyridinylmetyl, phenylcarbonyl, phenylcarbonylalkyl, phenoxy, phenyletynyl, phenylsulfonyl, 2-, 3- hoặc 4-pyridinyloxy hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này tùy ý được thế trên thành phần của vòng bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{14}$ ;

mỗi  $R^{13}$  và  $R^{14}$  độc lập là halogen, xyano, hydroxy, amino, nitro,  $-CHO$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-SO_2NH_2$ ,  $C_1-C_6$  alkyl,  $C_1-C_6$  haloalkyl,  $C_2-C_6$  alkenyl,  $C_2-C_6$  alkynyl,  $C_2-C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  alkoxycarbonyl,  $C_4-C_{10}$  xycloalkoxycarbonyl,  $C_5-C_{12}$  xycloalkylalkoxycarbonyl,  $C_2-C_8$  alkylaminocarbonyl,  $C_3-C_{10}$  dialkylaminocarbonyl,  $C_1-C_6$  alkoxy,  $C_1-C_6$  haloalkoxy,  $C_2-C_8$  alkylcarbonyloxy,  $C_1-C_6$  alkylthio,  $C_1-C_6$  haloalkylthio,  $C_1-C_6$  alkylsulfinyl,  $C_1-C_6$  haloalkylsulfinyl,  $C_1-C_6$  alkylsulfonyl,  $C_1-C_6$  haloalkylsulfonyl,  $C_1-C_6$  alkylaminosulfonyl,  $C_2-C_8$  dialkylaminosulfonyl,  $C_3-C_{10}$  trialkylsilyl,  $C_1-C_6$  alkylamino,  $C_2-C_8$  dialkylamino,  $C_2-C_8$  alkylcarbonylamino,  $C_1-C_6$  alkylsulfonylamino, phenyl, pyridinyl hoặc thienyl;

mỗi  $R^{15}$  độc lập là halogen, xyano, hydroxy,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl,  $C_1-C_4$  alkoxy,  $C_1-C_4$  haloalkoxy,  $C_2-C_4$  alkoxyalkyl,  $C_2-C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_4$  alkoxycarbonyl,  $C_3-C_6$  xycloalkyl hoặc  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl; hoặc

hai nhóm  $R^{15}$  cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử mà chúng liên kết vào tạo thành vòng  $C_3-C_7$  xycloalkyl;

mỗi  $R^{16}$  độc lập là xyano,  $C_1-C_4$  alkyl,  $C_1-C_4$  haloalkyl,  $C_1-C_4$  alkoxy,  $C_2-C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_4$  alkoxycarbonyl hoặc  $C_3-C_6$  xycloalkyl;

mỗi  $R^{17}$  độc lập là H,  $C_1-C_6$  alkyl,  $C_3-C_8$  xycloalkyl,  $C_4-C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1-C_6$  haloalkyl,  $C_2-C_6$  alkenyl,  $C_3-C_6$  alkynyl,  $C_2-C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2-C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_2-C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2-C_8$  haloalkylcarbonyl,

C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy carbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi R<sup>17a</sup> độc lập là H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi R<sup>18</sup> độc lập là H, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy carbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi R<sup>19</sup> độc lập là H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylthioalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfinylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylsulfonylalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkylcarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> haloalkoxy carbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> dialkylaminocarbonyl, C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub> xycloalkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalkylsulfonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> xycloalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminosulfonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> dialkylaminosulfonyl hoặc C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> trialkylsilyl; hoặc G<sup>1</sup>;

mỗi  $R^{20}$  độc lập là H, hydroxy, amino,  $C_1$ – $C_6$  alkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_4$ – $C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_6$  alkenyl,  $C_3$ – $C_6$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkylcarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxycarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxycarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkoxycarbonyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylaminocarbonyl,  $C_3$ – $C_{10}$  dialkylaminocarbonyl,  $C_4$ – $C_{10}$  xycloalkylaminocarbonyl,  $C_1$ – $C_6$  alkoxy,  $C_1$ – $C_6$  alkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkylsulfinyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylsulfinyl,  $C_1$ – $C_6$  alkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkylsulfonyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkylsulfonyl,  $C_1$ – $C_6$  alkylaminosulfonyl,  $C_2$ – $C_8$  dialkylaminosulfonyl hoặc  $C_3$ – $C_{10}$  trialkylsilyl; hoặc  $G^1$ ;

mỗi  $R^{20a}$  độc lập là H,  $C_1$ – $C_6$  alkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_4$ – $C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1$ – $C_6$  haloalkyl,  $C_2$ – $C_6$  alkenyl,  $C_3$ – $C_6$  alkynyl,  $C_2$ – $C_8$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  haloalkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylthioalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfinylalkyl,  $C_2$ – $C_8$  alkylsulfonylalkyl,  $C_1$ – $C_6$  alkoxy hoặc  $C_3$ – $C_{10}$  trialkylsilyl; hoặc  $G^1$ ;

mỗi  $R^{23b}$  độc lập là H, halogen, xyano, hydroxy,  $C_1$ – $C_4$  alkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_4$ – $C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1$ – $C_4$  haloalkyl,  $C_1$ – $C_4$  alkoxy,  $C_1$ – $C_4$  haloalkoxy,  $C_2$ – $C_4$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_4$  alkoxycarbonyl hoặc  $C_3$ – $C_6$  xycloalkyl;

mỗi  $R^{24a}$  độc lập là H,  $C_1$ – $C_4$  alkyl,  $C_3$ – $C_8$  xycloalkyl,  $C_4$ – $C_8$  xycloalkylalkyl,  $C_1$ – $C_4$  haloalkyl,  $C_1$ – $C_4$  alkoxy,  $C_1$ – $C_4$  haloalkoxy,  $C_2$ – $C_4$  alkoxyalkyl,  $C_2$ – $C_4$  alkylcarbonyl,  $C_2$ – $C_4$  alkoxycarbonyl hoặc  $C_3$ – $C_6$  xycloalkyl; và

mỗi u và v độc lập là 0, 1 hoặc 2 trong mỗi trường hợp  $S(=O)_u(=NR^8)_v$ , với điều kiện tổng của u và v bằng 0, 1 hoặc 2;

với điều kiện khi A là nguyên tử S và  $Q^1$  là phenyl không được thế,  $Q^2$  không phải là phenyl không được thế.

## 2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

A là  $-CH_2-$ ,  $-CH_2O-$ ,  $-CH_2NH-$ ,  $-OCH_2-$ ,  $-NHCH_2-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C\equiv C-$ ,  $-NH-$  hoặc  $-O-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $Q^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1;

$Q^1$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ ;

$Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ ;

$Y^1$  và  $Y^2$  đều là O; và

J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-$ .

3. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{NH}-$  hoặc  $-\text{O}-$ , trong đó liên kết tự do hướng về phía trái biểu thị điểm liên kết của A với  $\text{Q}^1$  và liên kết tự do hướng về phía phải biểu thị điểm liên kết của A với phần còn lại của công thức 1;

$\text{Q}^1$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 2 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$ ;

$\text{Q}^2$  là vòng phenyl được thế bằng tối đa 3 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^{10}$ ;

$\text{Y}^1$  và  $\text{Y}^2$  đều là O; và

J là  $-\text{CR}^2\text{R}^3-\text{CR}^{2a}\text{R}^{3a}-$ .

4. Hợp chất theo điểm 2, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ;

$\text{R}^1$  là H, Me hoặc Et;

$\text{R}^2$  là H;

$\text{R}^3$  là H;

$\text{R}^4$  là H;

$\text{R}^5$  là H;

$\text{R}^6$  là H;

$\text{R}^7$  độc lập là độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  xyanoalkyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  xyanoalkoxy,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkenyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  haloalkenyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkynyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  haloalkynyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  nitroalkyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  nitroalkenyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  xycloalkyl,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_4-\text{C}_{10}$  xycloalkylalkyl,  $\text{C}_4-\text{C}_{10}$  alkylxycloalkyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkoxy,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkoxy,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkenyloxy,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  haloalkenyloxy,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  alkynyloxy,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  haloalkynyloxy,  $\text{C}_3-\text{C}_8$  xycloalkoxy,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkylthio,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkylthio,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkylsulfinyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkylsulfinyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkylsulfonyl,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkylcarbonyl,  $\text{C}_2-\text{C}_8$  alkylcarbonyloxy,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  alkylsulfonyloxy,  $\text{C}_1-\text{C}_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $\text{C}_1-\text{C}_4$  alkylamino,  $\text{C}_2-\text{C}_4$  dialkylamino, formylamino,  $\text{C}_2-\text{C}_4$  alkylcarbonylamino,  $-\text{SF}_5$ ,  $-\text{SCN}$ ,  $\text{C}_3-\text{C}_{12}$  trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; và

$\text{R}^{10}$  độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1-\text{C}_2$  alkyl,  $\text{C}_1-\text{C}_3$  haloalkyl hoặc  $\text{C}_1-\text{C}_3$  alkylsulfonyl.

## 5. Hợp chất theo điểm 3, trong đó:

A là  $-\text{CH}_2-$ ; $\text{R}^1$  là H, Me hoặc Et; $\text{R}^2$  là H; $\text{R}^3$  là H; $\text{R}^{2a}$  là H; $\text{R}^{3a}$  là H; $\text{R}^4$  là H; $\text{R}^5$  là H; $\text{R}^6$  là H;

$\text{R}^7$  độc lập là độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  xyanoalkyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  xyanoalkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkynyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkynyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  nitroalkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  nitroalkenyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkoxyalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  alkoxyalkoxyalkyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  xycloalkyl,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  haloalkoxyalkyl,  $\text{C}_4$ – $\text{C}_{10}$  xycloalkylalkyl,  $\text{C}_4$ – $\text{C}_{10}$  alkylxycloalkyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkoxy,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkenyloxy,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  haloalkenyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  alkynyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  haloalkynyloxy,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_8$  xycloalkoxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylthio,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylthio,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylsulfinyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylsulfinyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylsulfonyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkylcarbonyl,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_8$  alkylcarbonyloxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  alkylsulfonyloxy,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_8$  haloalkylsulfonyloxy, amino,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_4$  alkylamino,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_4$  dialkylamino, formylamino,  $\text{C}_2$ – $\text{C}_4$  alkylcarbonylamino,  $-\text{SF}_5$ ,  $-\text{SCN}$ ,  $\text{C}_3$ – $\text{C}_{12}$  trialkylsilyl, trimethylsilylmethyl hoặc trimethylsilylmetoxy; và

$\text{R}^{10}$  độc lập là halogen, xyano, nitro,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_2$  alkyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_3$  haloalkyl hoặc  $\text{C}_1$ – $\text{C}_3$  alkylsulfonyl.

## 6. Hợp chất theo điểm 4, trong đó:

mỗi  $\text{R}^7$  độc lập là halogen, xyano,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_2$  alkyl,  $\text{C}_1$ – $\text{C}_3$  haloalkyl hoặc  $\text{C}_1$ – $\text{C}_3$  alkylsulfonyl; và

mỗi  $\text{R}^{10}$  độc lập là halogen hoặc  $\text{C}_1$ – $\text{C}_2$  haloalkyl.

## 7. Hợp chất theo điểm 6 trong đó

$\text{Q}^1$  là vòng phenyl được thế bằng 1 phần tử thế độc lập được chọn từ  $\text{R}^7$ ;

$Q^2$  là vòng phenyl có 2 phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và một trong số các phần tử thế này là ở vị trí ortho và phần tử thế khác nêu trên là ở vị trí meta hoặc para.

8. Hợp chất theo điểm 6, trong đó:

$Q^2$  là vòng phenyl được thế bằng ba phần tử thế được chọn từ  $R^{10}$  và ba phần tử thế là ở vị trí ortho, meta và para của vòng phenyl.

9. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

A được chọn từ  $-\text{ON}=\text{CH}-$ ,  $-\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{NHN}=\text{CH}-$ ,  $-\text{NHN}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{N}=\text{CH}-$ ,  $-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ ,  $-\text{CH}=\text{NO}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NO}-$ ,  $-\text{CH}=\text{NNH}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NNH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{N}-$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CF}_2-$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $\text{C}\equiv\text{CC}:\text{H}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{O}-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{OCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{S}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$ ,  $-\text{SO}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{SCH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{NH}-$ ,  $-\text{NH}-$ ,  $-\text{NHCH}_2-$  và  $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2-$ , trong đó liên kết hướng về phía trái được liên kết với nhóm  $Q^1$ , và liên kết hướng về phía phải được liên kết với phần còn lại của công thức 1;

$Q^1$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng từ 1 đến 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$ ; hoặc vòng dị thơm có 5 đến 6 cạnh chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, tùy ý được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^7$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $R^9$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng;

$Q^2$  là vòng phenyl tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{10}$ ; hoặc vòng dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn có 5 đến 6 cạnh, mỗi vòng chứa các thành phần trong vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 nguyên tử O, tối đa 2 nguyên tử S và tối đa 4 nguyên tử N, mỗi vòng hoặc hệ vòng này tùy ý được thế bằng tối đa 5 phần tử thế độc lập được chọn từ  $R^{11}$  trên các thành phần nguyên tử cacbon của vòng và được chọn từ  $R^{11}$  thành phần nguyên tử nitơ của vòng;

$Y^1$  và  $Y^2$  đều là O;

$R^1$  là H, hydroxy, amino, xyano, formyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonylalkyl, -C(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl)=N-O(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkyl), -C(O)NH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> xyanoalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> xycloalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl hoặc C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl;

$R^6$  là H, hydroxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl hoặc C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl;

mỗi  $R^7$  độc lập là halogen, xyano, nitro, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> xycloalkylalkyl, C<sub>4</sub>–C<sub>10</sub> alkylxycloalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxy, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkenyloxy, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkenyloxy, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkynyloxy, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> haloalkynyloxy, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyl, hydroxy, formyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkylsulfonyloxy, amino, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub> alkylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> dialkylamino, formylamino, C<sub>2</sub>–C<sub>4</sub> alkylcarbonylamino, -SF<sub>5</sub>, -SCN, C<sub>3</sub>–C<sub>12</sub> trialkylsilyl, trimethylsilylmetyl hoặc trimethylsilylmetoxy; và

mỗi  $R^{10}$  độc lập là halogen, hydroxy, xyano, nitro, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> alkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> xyanoalkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> haloalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkynyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkynyl, C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> nitroalkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> alkoxyalkoxyalkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub> haloalkoxyalkyl hoặc C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub> xycloalkyl.

10. Hợp chất theo điểm 1 được chọn từ nhóm bao gồm:

N-(2,3-diflophenyl)-4-[(4-flophenyl)metyl]-2-oxo-3-pyrolidincarboxamit; và  
4-[(3-clophenyl)metyl]-N-(2,3-diflophenyl)-2-oxo-3-pyrolidincarboxamit.

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

12. Chế phẩm diệt cỏ chứa hợp chất theo điểm 1, ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm thuốc diệt cỏ khác và chất an toàn diệt cỏ (safener), và ít nhất một thành phần được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng

13. Hỗn hợp diệt cỏ chứa (a) hợp chất theo điểm 1, và (b) ít nhất một hoạt chất bổ sung được chọn từ (b1) chất ức chế quang hệ II, (b2) chất ức chế synthaza của axit axetohydroxy (AHAS), (b3) chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza (ACCaza), (b4) chất đẳng hiệu auxin, (b5) chất ức chế 5 enol-pyruvylshikimat-3-phosphat (EPSP) syntaza, (b6) chất phân chia điện tử quang hệ I, (b7) chất ức chế protoporphyrinogen oxidaza (PPO), (b8) chất ức chế glutamin synthetaza (GS), (b9) chất ức chế elongaza của axit béo mạch rất dài (VLCFA), (b10) chất ức chế vận chuyển auxin, (b11) chất ức chế phytoen desaturaza (PDS), (b12) chất ức chế 4-hydroxyphenyl pyruvat dioxyaza (HPPD), (b13) chất ức chế homogentisat solenesyltranseraza (HST), (b14) chất ức chế sinh tổng hợp xenluloza, (b15) thuốc diệt cỏ khác bao gồm chất phá vỡ quá trình nguyên phân, hợp chất asen hữu cơ, asulam, bromobutit, xinmetylin, cumyluron, dazomet, difenzoquat, dymron, etobenzanit, flurenol, fosamin, fosamin-amoni, metam, metyldymron, axit oleic, oxaziclomefon, axit pelargonic và pyributicarb, và (b16) chất an toàn diệt cỏ (safener); và các muối của các hợp chất từ (b1) đến (b16)

14. Phương pháp phòng trừ sự sinh trưởng của thực vật không mong muốn bao gồm bước cho thực vật hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt cỏ của hợp chất theo điểm 1.