



(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)



1-0031555

(51)⁷ C07D 471/04

(13) B

(21) 1-2018-01259

(22) 23/09/2016

(86) PCT/EP2016/072697 23/09/2016

(87) WO2017/055185 06/04/2017

(30) 15187145.6 28/09/2015 EP

(45) 25/04/2022 409

(43) 27/08/2018 365A

(73) Bayer Cropscience Aktiengesellschaft (DE)

Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany

(72) WILCKE, David (DE); FISCHER, Rüdiger (DE); HAGER, Dominik (DE);

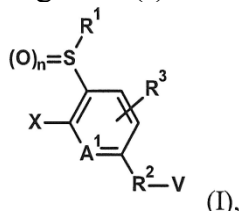
KAUSCH-BUSIES, Nina (DE); HOFFMEISTER, Laura (DE); ILG, Kerstin (DE);

GÖRGENS, Ulrich (DE); PORTZ, Daniela (DE); TURBERG, Andreas (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG NGỪNG TỰ ĐƯỢC THỂ 2-(HET)ARYL, SẢN PHẨM HÓA NÔNG, CHẾ PHẨM HÓA NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT SINH VẬT GÂY HẠI

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



trong đó R^1 , R^2 , R^3 , A^1 , V , X và n có ý nghĩa như được nêu trong bản mô tả. Hợp chất này là hữu ích để làm các chất diệt ve bét và/hoặc các chất diệt côn trùng để kiểm soát động vật gây hại. Sáng chế cũng đề cập đến sản phẩm hóa nông, chế phẩm hóa nông chứa hợp chất này để kiểm soát một hoặc nhiều loài động vật gây hại và phương pháp kiểm soát sinh vật gây hại.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến dẫn xuất dị vòng ngưng tụ được thế 2-(het)aryl có công thức (I). Hợp chất này là hữu ích để làm chất diệt ve bét và chất diệt côn trùng để kiểm soát các loài động vật gây hại, cụ thể là các loài động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng và động vật thuộc lớp nhện. Sáng chế còn đề cập đến sản phẩm hóa nông, chế phẩm hóa nông chứa hợp chất này để kiểm soát một hoặc nhiều loài động vật gây hại, phương pháp kiểm soát sinh vật gây hại và các quy trình và các hợp chất trung gian để điều chế chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

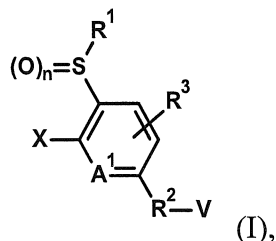
Dẫn xuất dị vòng ngưng tụ với các đặc tính diệt côn trùng đã được mô tả trong tài liệu, ví dụ trong tài liệu WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, EP 15153943.4, EP 15153948.3, WO 2015/121136, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286 và WO 2016/046071.

Tuy nhiên, các hợp chất hoạt tính đã biết theo các tài liệu nêu trên có một số bất lợi khi áp dụng, hoặc vì chúng chỉ thể hiện phổ áp dụng hẹp, hoặc vì chúng không có hoạt tính diệt côn trùng hoặc diệt ve bét thỏa đáng.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề xuất các dẫn xuất dị vòng ngưng tụ được thế 2-(het)aryl, và các dẫn xuất này có ưu điểm so với các hợp chất đã biết, ví dụ chúng có các đặc tính sinh học và môi trường tốt hơn, phạm vi phương pháp áp dụng rộng hơn, hoạt tính diệt côn trùng và diệt ve bét tốt hơn, và còn có độ tương thích tốt với cây trồng. Các dẫn xuất dị vòng ngưng tụ được thế 2-(het)aryl có thể được sử dụng kết hợp với các chất khác để cải thiện hiệu lực, đặc biệt là đối với các loài côn trùng mà khó kiểm soát. Sáng chế còn đề xuất sản phẩm hóa nông, chế phẩm hóa nông chứa hợp chất này để kiểm soát một hoặc nhiều loài động vật gây hại, phương pháp kiểm soát sinh vật gây hại và các quy trình và các hợp chất trung gian để điều chế chúng.

Để đạt được mục đích trên đây, theo một khía cạnh, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I):



trong đó (công thức 1),

A^1 là nitơ, $=N^+(O^-)$ - hoặc $=C(R^4)-$,

R^1 là (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, aminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)alkyl,

hoặc là các nhóm sau trong mỗi trường hợp tùy ý được thể một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thể aryl, hetaryl- hoặc heteroxycyl giống nhau hoặc khác nhau: (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, trong đó aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl trong mỗi trường hợp tùy ý có thể được thể một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau sau: halogen,

xyano, nitro, hydroxy, amino, carboxy, carbamoyl, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl hoặc benzyl hoặc

R¹ là aryl, hetaryl hoặc heteroxycyl, mỗi một trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có halogen, xyano, nitro, hydroxy, amino, carboxy, carbamoyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfimino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino-(C₂-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₃-C₆)trialkylsilyl, (=O) (duy nhất trong trường hợp heteroxycyl) và (=O)₂ (duy nhất trong trường hợp heteroxycyl),

R² là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, và trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại, trong đó trong mỗi trường hợp tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl,

(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino,

- V là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, và trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại, hoặc là vòng thơm được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó trong mỗi trường hợp tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-

(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocabonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino,

R³ là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)halogenalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-

C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcarbonylamino),

là aryl hoặc hetaryl, mỗi một trong số các nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyno, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino,

R⁴ là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-

C_8)xycloalkyl, halo(C_3 - C_8)xycloalkyl, (C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)haloalkyl, (C_1 - C_6)xyanoalkyl, (C_1 - C_6)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C_1 - C_6)-alkoxy, (C_1 - C_6)alkoxycarbonyl-(C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)alkoxy-(C_1 - C_6)alkyl, (C_2 - C_6)alkenyl, (C_2 - C_6)haloalkenyl, (C_2 - C_6)xyanoalkenyl, (C_2 - C_6)alkynyl, (C_2 - C_6)haloalkynyl, (C_2 - C_6)xyanoalkynyl, (C_1 - C_6)alkoxy, (C_1 - C_6)haloalkoxy, (C_1 - C_6)xyanoalkoxy, (C_1 - C_6)alkoxycarbonyl-(C_1 - C_6)alkoxy, (C_1 - C_6)alkoxy-(C_1 - C_6)alkoxy, (C_1 - C_6)alkylhydroxyimino, (C_1 - C_6)alkoxyimino, (C_1 - C_6)alkyl-(C_1 - C_6)alkoxyimino, (C_1 - C_6)haloalkyl-(C_1 - C_6)alkoxyimino, (C_1 - C_6)alkylthio, (C_1 - C_6)haloalkylthio, (C_1 - C_6)alkoxy-(C_1 - C_6)alkylthio, (C_1 - C_6)alkylthio-(C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)alkylsulfinyl, (C_1 - C_6)haloalkylsulfinyl, (C_1 - C_6)alkoxy-(C_1 - C_6)alkylsulfinyl, (C_1 - C_6)alkylsulfinyl-(C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)alkylsulfonyl, (C_1 - C_6)haloalkylsulfonyl, (C_1 - C_6)alkoxy-(C_1 - C_6)alkylsulfonyl, (C_1 - C_6)alkylsulfonyl-(C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)alkylsulfonyloxy, (C_1 - C_6)alkylcarbonyl, (C_1 - C_6)alkylthiocarbonyl, (C_1 - C_6)haloalkylcarbonyl, (C_1 - C_6)alkylcarbonyloxy, (C_1 - C_6)alkoxycarbonyl, (C_1 - C_6)halogenalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C_1 - C_6)alkylaminocarbonyl, (C_1 - C_6)alkylaminothiocarbonyl, di-(C_1 - C_6)alkylaminocarbonyl, di-(C_1 - C_6)alkylaminothiocarbonyl, (C_2 - C_6)alkenylaminocarbonyl, di-(C_2 - C_6)-alkenylaminocarbonyl, (C_3 - C_8)xycloalkylaminocarbonyl, (C_1 - C_6)alkylsulfonylamino, (C_1 - C_6)alkylamino, di-(C_1 - C_6)alkylamino, aminosulfonyl, (C_1 - C_6)alkylaminosulfonyl, di-(C_1 - C_6)alkylaminosulfonyl, (C_1 - C_6)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C_1 - C_6)alkylaminothiocarbonyl, di-(C_1 - C_6)alkyl-aminothiocarbonyl, (C_3 - C_8)xycloalkylamino, hoặc

-NHCO-(C_1 - C_6)alkyl ((C_1 - C_6)alkylcarbonylamino),

- X là hệ vòng hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ, dị vòng hoặc dị vòng thơm, no một phần hoặc no, có 8, 9, 10, 11 hoặc 12 cạnh, trong đó tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó hệ vòng tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế, độc lập với nhau, có thể được lựa chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri(C_1 - C_6)alkylsilyl, (C_3 - C_8)xycloalkyl, (C_3 - C_8)xycloalkyl-(C_3 - C_8)xycloalkyl, (C_1 - C_6)alkyl-(C_3 - C_8)xycloalkyl, halo(C_3 - C_8)xycloalkyl, (C_1 - C_6)alkyl, (C_1 - C_6)haloalkyl, (C_1 - C_6)xyanoalkyl, (C_1 - C_6)hydroxyalkyl,

hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcarbonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế độc lập với nhau có thể được lựa chọn từ phenyl hoặc vòng dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng tùy ý có thể được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

n là 0, 1 hoặc 2.

Ngoài ra, cũng đã phát hiện ra rằng, hợp chất có công thức (I) có hiệu lực rất tốt làm chất diệt sinh vật gây hại, tốt hơn là chất diệt côn trùng và/hoặc chất diệt ve bét, nói chung thêm nữa, chúng còn có độ tương thích rất tốt, cụ thể là đối với cây trồng.

Định nghĩa chung về hợp chất theo sáng chế được cung cấp bằng công thức (I). Các phần tử thể được ưu tiên hoặc phạm vi về các gốc được đưa ra trong các công thức nêu trên và dưới đây được minh họa sau đây:

Công thức 2

A¹ là nitor, =N⁺(O⁻)- hoặc =C(R⁴)-,

R¹ tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, (C₃-C₆)xycloalkylamino, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino,

hoặc là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, mỗi một trong số này tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có aryl, hetaryl và heteroxyclyl, trong đó aryl, hetaryl và heteroxyclyl trong mỗi trường hợp tùy ý có thể được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có halogen, xyano, carbamoyl, aminosulfonyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₃-C₄)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfinino, hoặc

R¹ tốt hơn là aryl, hetaryl hoặc heteroxyclyl, mỗi một trong số này tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có

halogen, xyano, carbamoyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfimino, (C₁-C₄)alkylsulfoximino, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₃-C₄)trialkylsilyl, (=O) (duy nhất trong trường hợp heteroxycyl) và (=O)₂ (duy nhất trong trường hợp heteroxycyl),

R² tốt hơn là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại từ nhóm gồm có N, O và S, trong đó trong mỗi trường hợp tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₄)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino,

V tốt hơn là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, và trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại từ nhóm N, O hoặc S, hoặc là vòng thơm tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó trong mỗi trường hợp tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-

(C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₄)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino,

R³ tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, aminothiocarbonyl, NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-

C₄)alkylcarbonylamino),

ngoài ra, tốt hơn là phenyl hoặc hetaryl, mỗi một trong số này tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) tùy ý ít nhất một nhóm carbonyl có thể có mặt và/hoặc trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino),

R⁴ tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri(C₁-C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl,

(C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, aminothiocabonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, aminothiocabonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino),

- X tốt hơn là hệ vòng dị vòng thơm có 8, 9, 10, 11 hoặc 12 cạnh, hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ, trong đó hệ vòng tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, và trong đó các phần tử thế, độc lập với nhau, có thể được lựa chọn từ hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocabonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocabonyl, di-(C₁-

C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, NHCO-(C₁-C₆)alkyl ((C₁-C₆)alkylcarbonylamino),

hoặc trong đó các phần tử thế độc lập với nhau có thể được lựa chọn từ phenyl hoặc vòng dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, trong đó phenyl hoặc vòng tùy ý có thể được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm có C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-haloxycloalkyl, halogen, CN, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy,

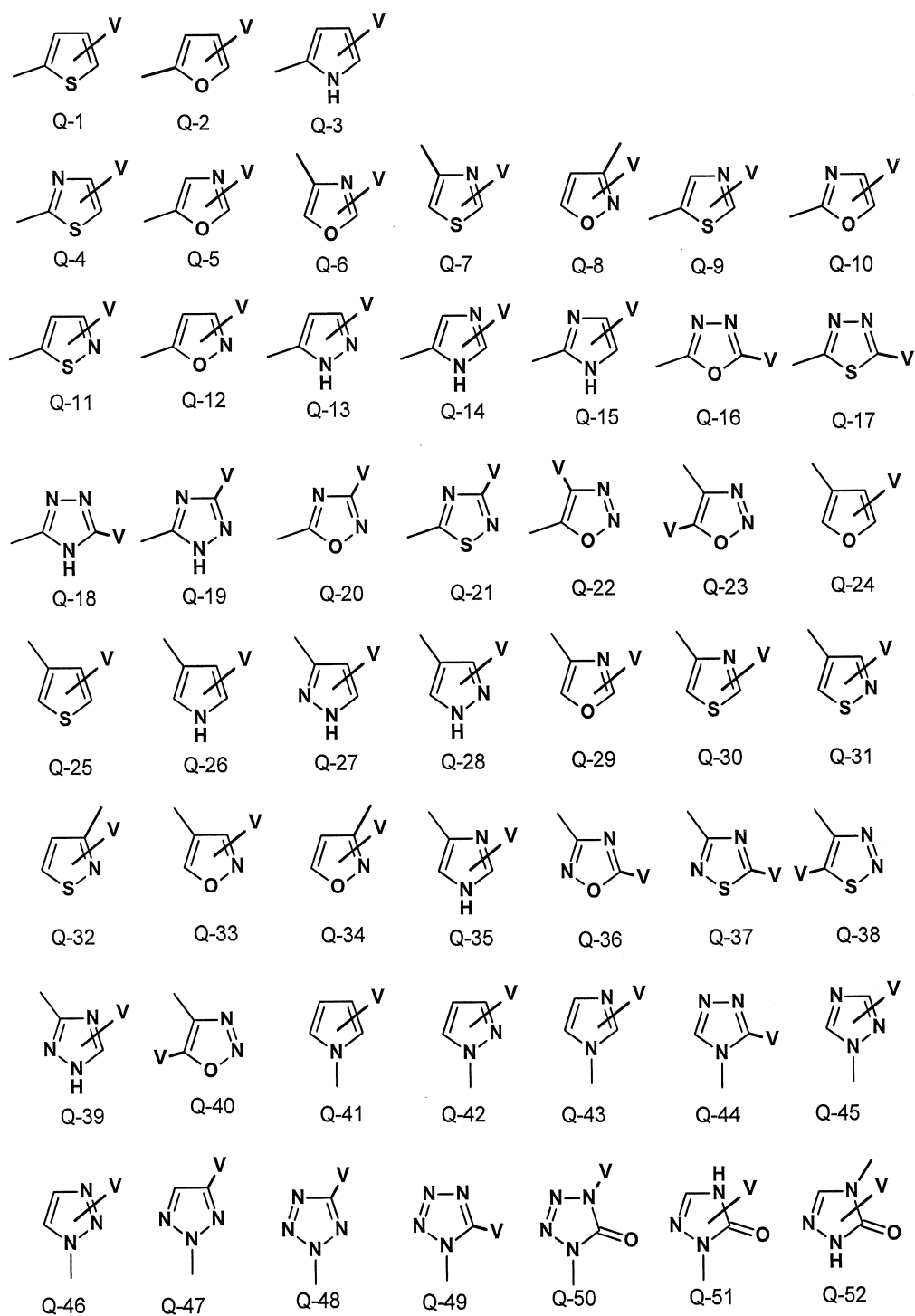
n tốt hơn là 0, 1 hoặc 2.

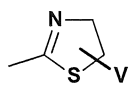
Công thức 3-1

A¹ đặc biệt tốt hơn là nitơ hoặc =C(R⁴)-,

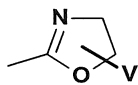
R¹ đặc biệt tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R^{2-V} đặc biệt tốt hơn là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ dãy nhóm từ Q-1 đến Q-80, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,

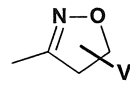




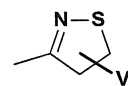
Q-53



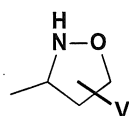
Q-54



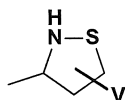
Q-55



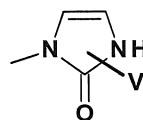
Q-56



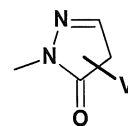
Q-57



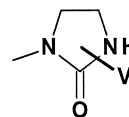
Q-58



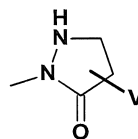
Q-59



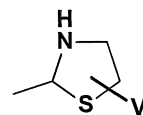
Q-60



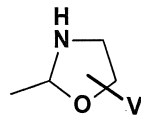
Q-61



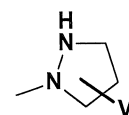
Q-62



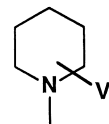
Q-63



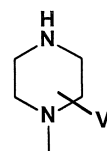
Q-64



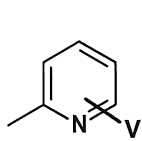
Q-65



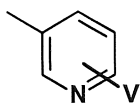
Q-66



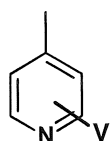
Q-67



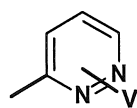
Q-68



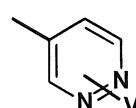
Q-69



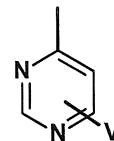
Q-70



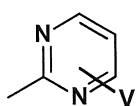
Q-71



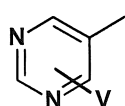
Q-72



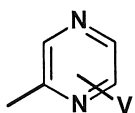
Q-73



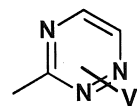
Q-74



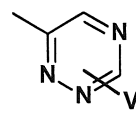
Q-75



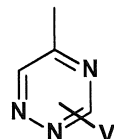
Q-76



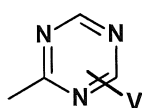
Q-77



Q-78



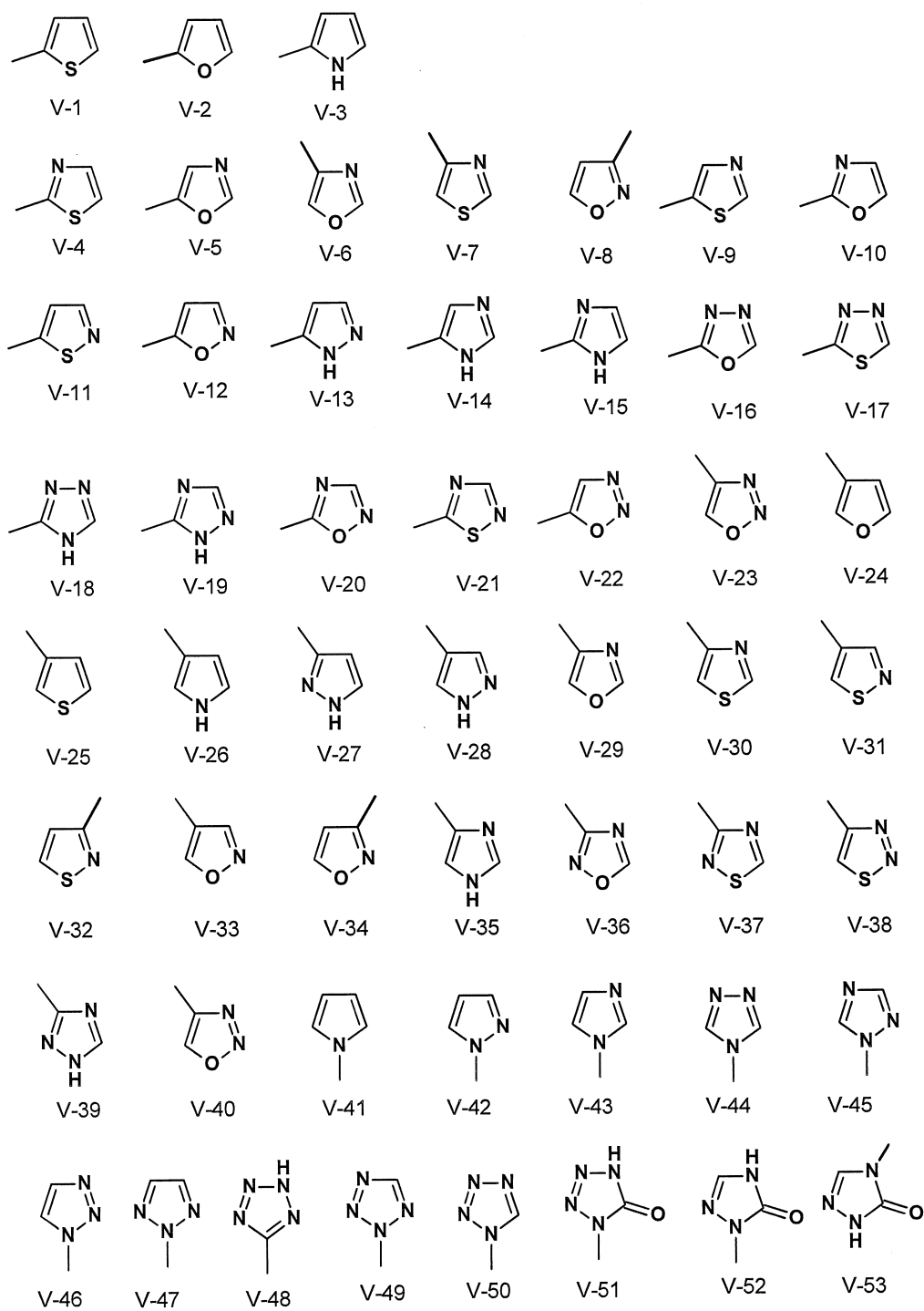
Q-79

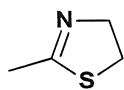


Q-80

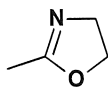
trong đó,

- V đặc biệt tốt hơn là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm V-1 đến V-101, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,

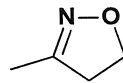




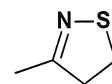
V-54



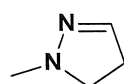
V-55



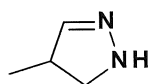
V-56



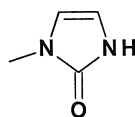
V-57



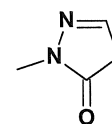
V-58



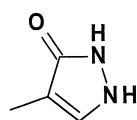
V-59



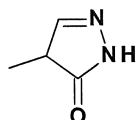
V-60



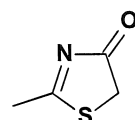
V-61



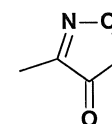
V-62



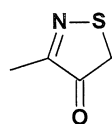
V-63



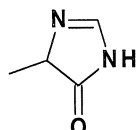
V-64



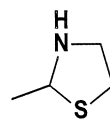
V-65



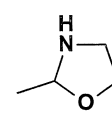
V-66



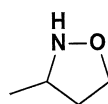
V-67



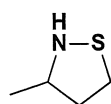
V-68



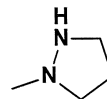
V-69



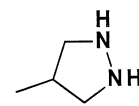
V-70



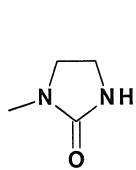
V-71



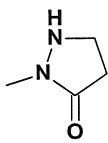
V-72



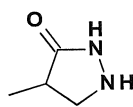
V-73



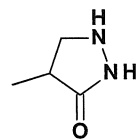
V-74



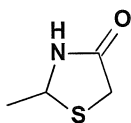
V-75



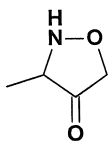
V-76



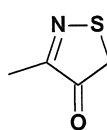
V-77



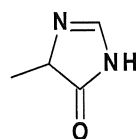
V-78



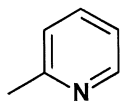
V-79



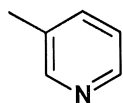
V-80



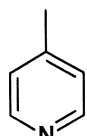
V-81



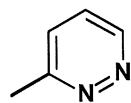
V-82



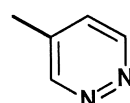
V-83



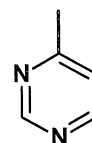
V-84



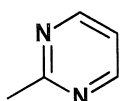
V-85



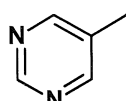
V-86



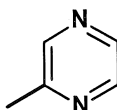
V-87



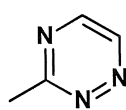
V-88



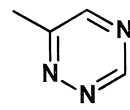
V-89



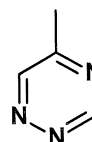
V-90



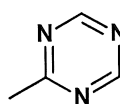
V-91



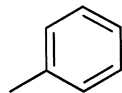
V-92



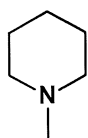
V-93



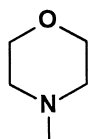
V-94



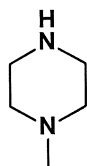
V-95



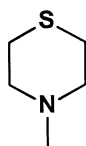
V-96



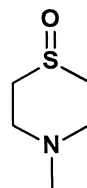
V-97



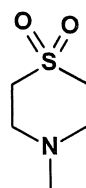
V-98



V-99



V-100



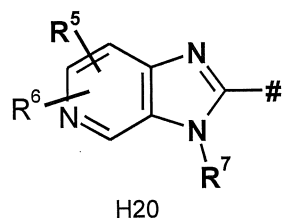
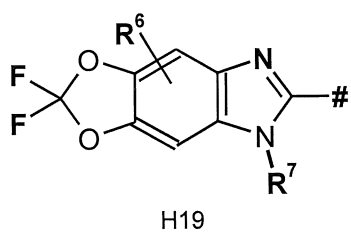
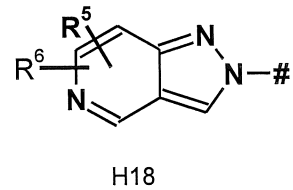
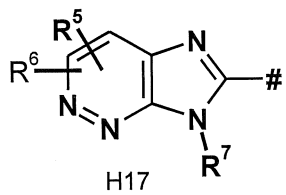
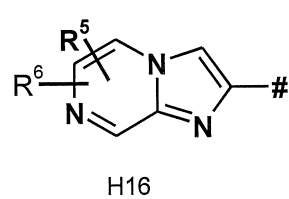
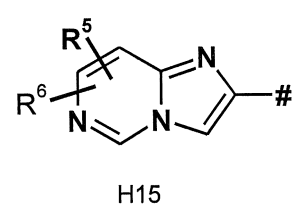
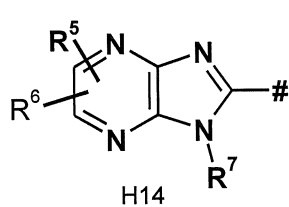
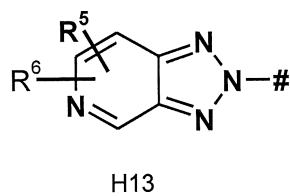
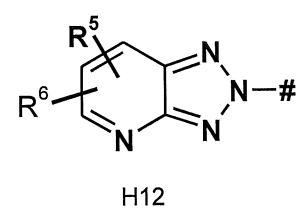
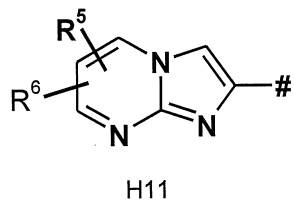
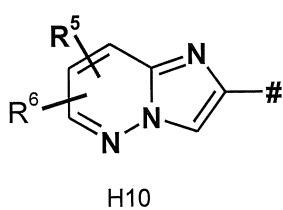
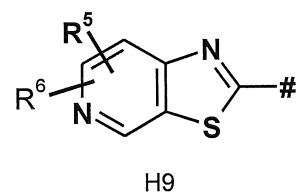
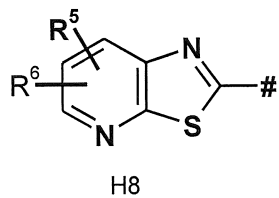
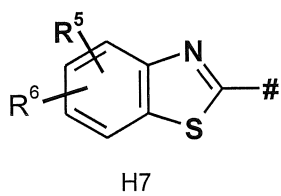
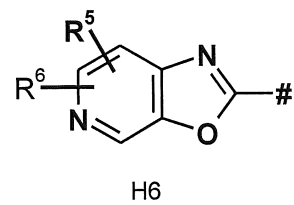
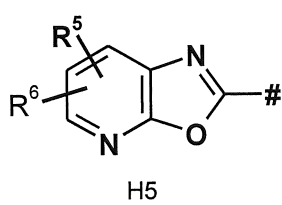
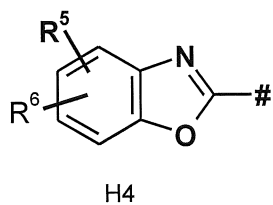
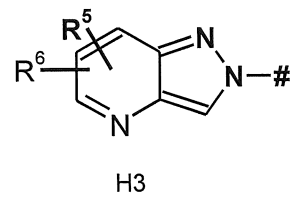
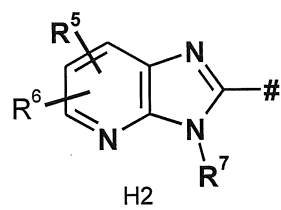
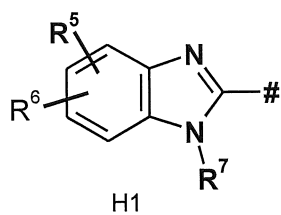
V-101

R³ đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-

(C₄)alkylsilyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di-(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl hoặc NHCO-(C₁-C₄)alkyl ((C₁-C₄)alkylcarbonylamino),

R⁴ đặc biệt tốt hơn là hydro, halogen, xyano hoặc (C₁-C₄)alkyl,

X đặc biệt tốt hơn là hệ vòng hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm từ H1 đến H20,



R^5, R^6 độc lập với nhau đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyloxy, (C_1-C_4) alkylcarbonyl, (C_1-C_4) haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C_1-C_4) alkylaminocarbonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminocarbonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonylamino, (C_1-C_4) alkylamino, di- (C_1-C_4) alkylamino, aminosulfonyl, (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl hoặc di- (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl,

R^7 đặc biệt tốt hơn là (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) xyanoalkyl, (C_1-C_4) hydroxyalkyl, (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) alkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) xyanoalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) alkynyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, halo- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfinyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl- (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl,

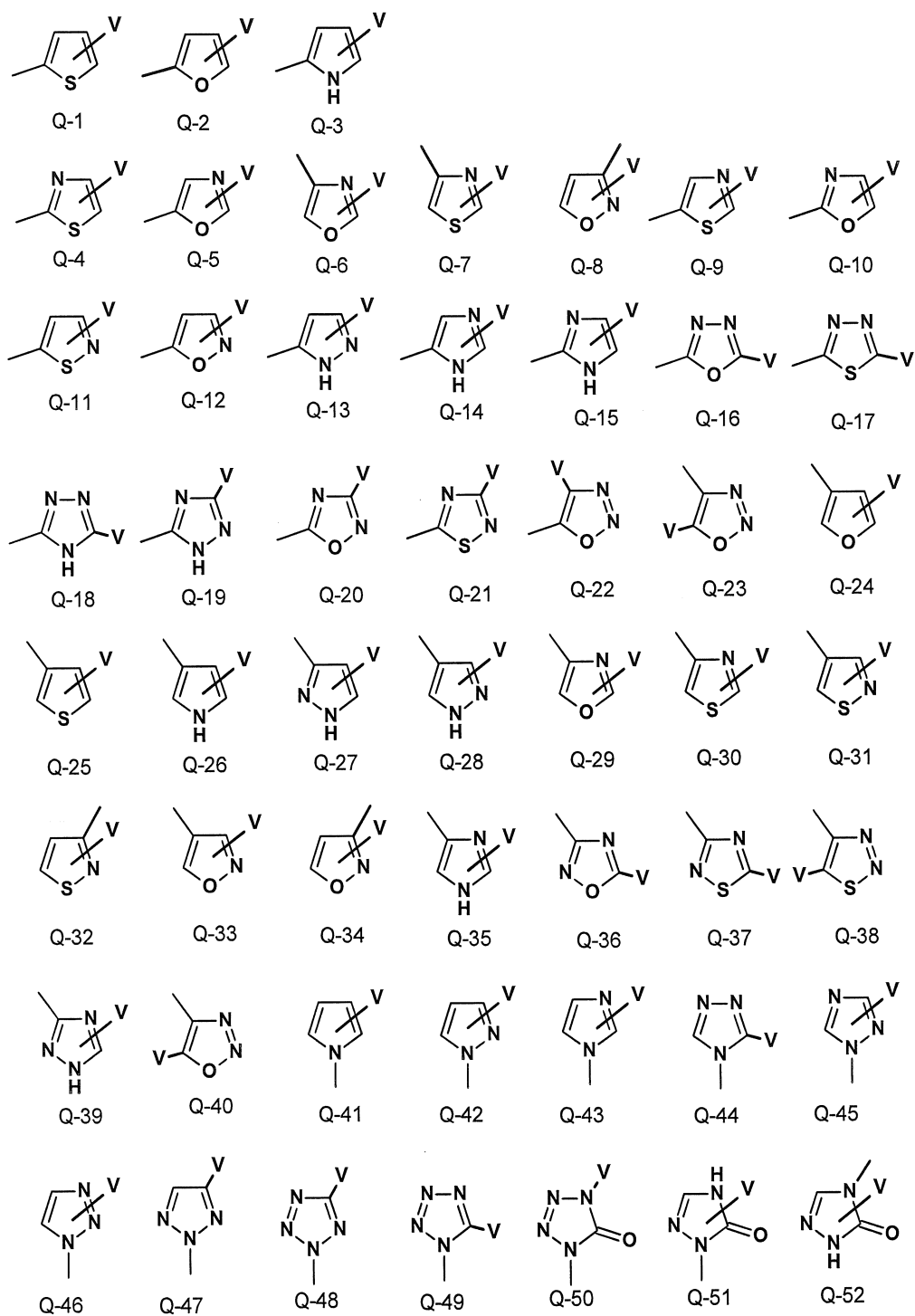
n đặc biệt tốt hơn là 0, 1 hoặc 2.

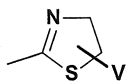
Theo phương án đặc biệt ưu tiên, R^2 tùy ý có thể được thế một lần hoặc hai lần, ngoài với V, bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy.

Công thức 3-2

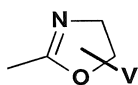
$A^1, R^1, R^3, R^4, X, R^5, R^6, R^7$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức 3-1 và

R^2-V đặc biệt tốt hơn là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ dãy nhóm từ Q-1 đến Q-80, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy,

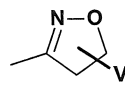




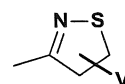
Q-53



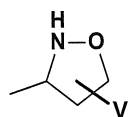
Q-54



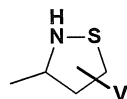
Q-55



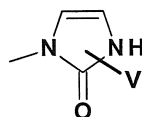
Q-56



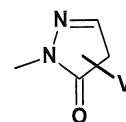
Q-57



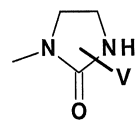
Q-58



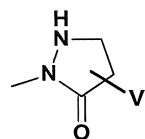
Q-59



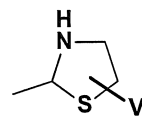
Q-60



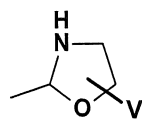
Q-61



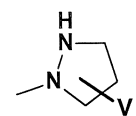
Q-62



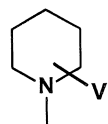
Q-63



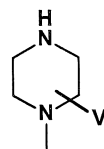
Q-64



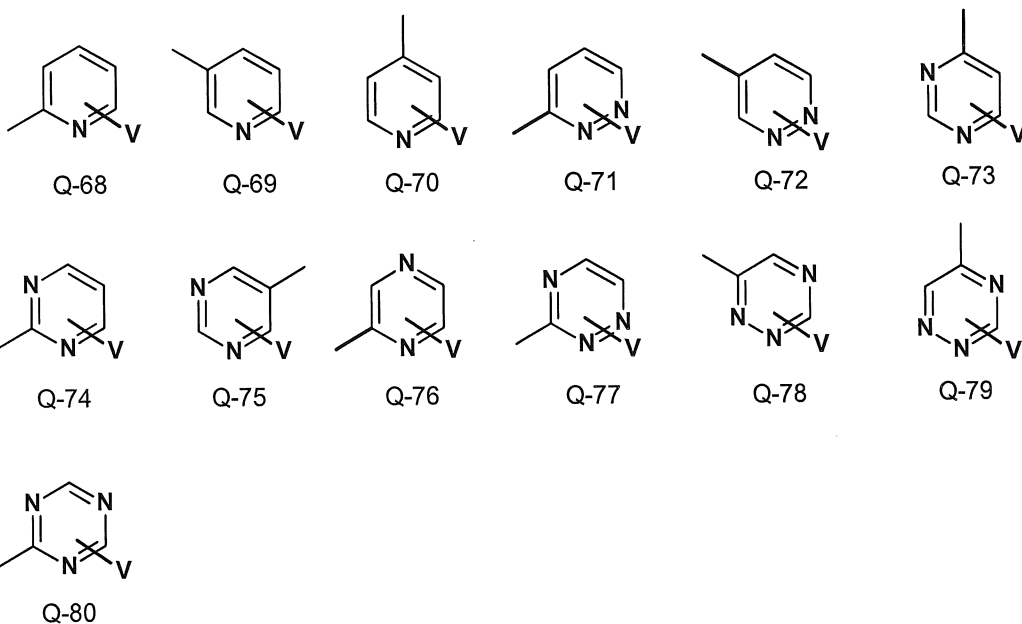
Q-65



Q-66

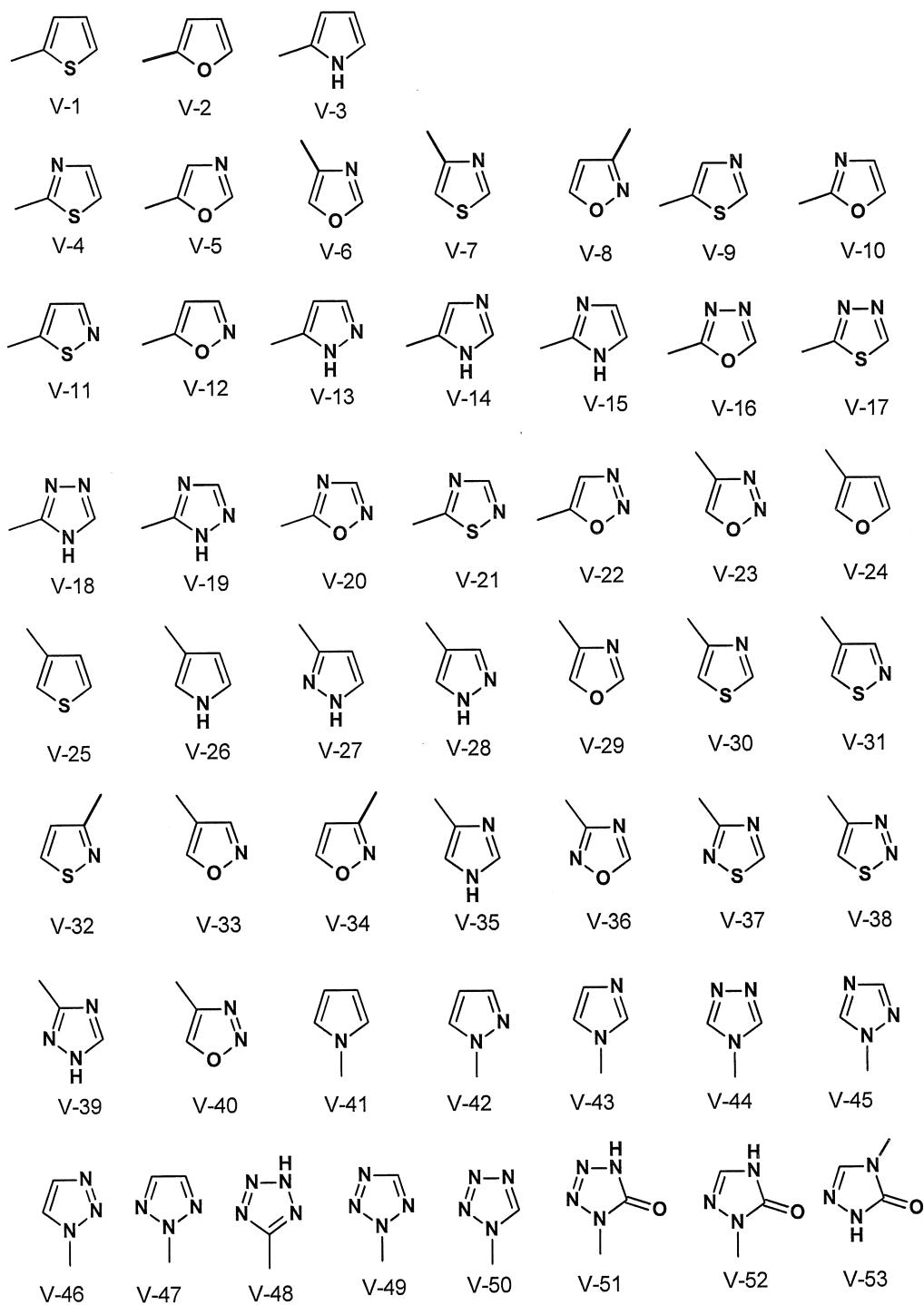


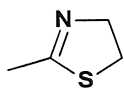
Q-67



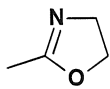
trong đó,

- V đặc biệt tốt hơn là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm V-1 đến V-101, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,

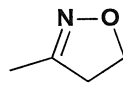




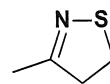
V-54



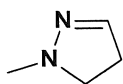
V-55



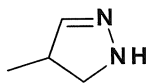
V-56



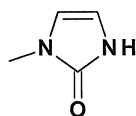
V-57



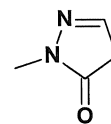
V-58



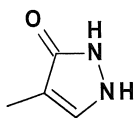
V-59



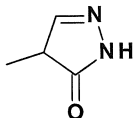
V-60



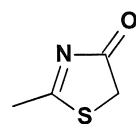
V-61



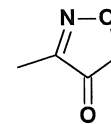
V-62



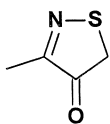
V-63



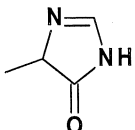
V-64



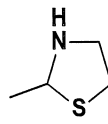
V-65



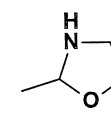
V-66



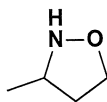
V-67



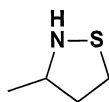
V-68



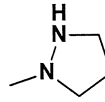
V-69



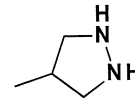
V-70



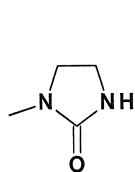
V-71



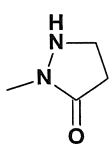
V-72



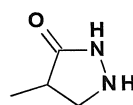
V-73



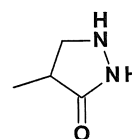
V-74



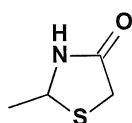
V-75



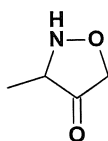
V-76



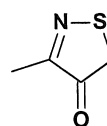
V-77



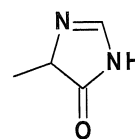
V-78



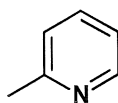
V-79



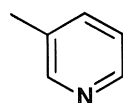
V-80



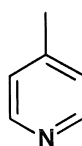
V-81



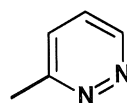
V-82



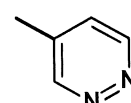
V-83



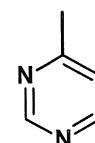
V-84



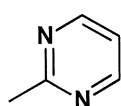
V-85



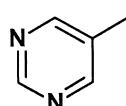
V-86



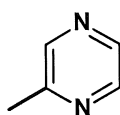
V-87



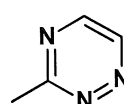
V-88



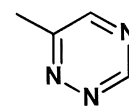
V-89



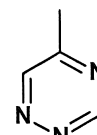
V-90



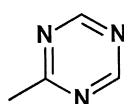
V-91



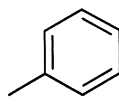
V-92



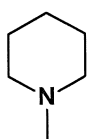
V-93



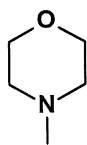
V-94



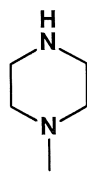
V-95



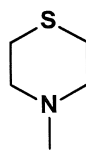
V-96



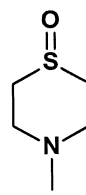
V-97



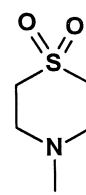
V-98



V-99



V-100



V-101

Theo phương án đặc biệt ưu tiên, R^2 tùy ý có thể được thế một lần hoặc hai lần, ngoài với V, bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy.

Công thức 4-1

A^1 tốt nhất là nitơ hoặc $=C(R^4)-$,

R^1 tốt nhất là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^2-V tốt nhất là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần từ nhóm Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-13, Q-14, Q-15, Q-16, Q-17, Q-24, Q-25, Q-26, Q-27, Q-28, Q-29, Q-30, Q-34, Q-35, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-55, Q-59, Q-61, Q-66, Q-67, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-74 hoặc Q-75, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, flo, clo, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy hoặc triflometoxy,

trong đó,

V tốt nhất là vòng tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy hoặc triflometoxy, được lựa chọn từ V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-6, V-7, V-9, V-10, V-16, V-17, V-18, V-19, V-20, V-21, V-24, V-25, V-27, V-28, V-29, V-30, V-35, V-36, V-39, V-42, V-43, V-44, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-52, V-53, V-60, V-82, V-83, V-84, V-85, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 hoặc V-101,

R^3 tốt nhất là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl hoặc $NHCO-(C_1-C_4)alkyl$ ($(C_1-C_4)alkylcarbonylamino$),

- X tốt nhất là hệ vòng hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh từ nhóm H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19, hoặc H20,
- R⁴ tốt nhất là hydro, flo, clo, brom hoặc xyano,
- R⁵ tốt nhất là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafluoretyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,
- R⁶ tốt nhất là hydro,
- R⁷ tốt nhất là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,
- n tốt nhất là 0, 1 hoặc 2.

Theo phương án đặc biệt rất được ưu tiên, R² tùy ý có thể được thế một lần, ngoài với V, bằng xyano, flo, clo, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy hoặc triflometoxy.

Công thức 4-2

A¹, R¹, R³, R⁴, X, R⁵, R⁶, R⁷ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức 4-1 and

R²-V tốt nhất là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần từ nhóm Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-13, Q-14, Q-15, Q-16, Q-17, Q-24, Q-25, Q-26, Q-27, Q-28, Q-29, Q-30, Q-34, Q-35, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-55, Q-59, Q-61, Q-66, Q-67, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-74 hoặc Q-75, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, flo, clo, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, triflometyl, metoxy hoặc triflometoxy,

trong đó,

V tốt nhất là vòng tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, triflometyl, metoxy hoặc triflometoxy, được lựa chọn từ V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-6, V-7, V-9, V-10, V-16, V-17, V-18, V-19, V-20, V-21, V-24, V-25, V-27, V-28, V-29, V-30, V-35, V-36, V-39,

V-42, V-43, V-44, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-52, V-53, V-60, V-82, V-83, V-84, V-85, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 hoặc V-101.

Theo phương án đặc biệt rất được ưu tiên, R² tùy ý có thể được thế một lần, ngoài với V, bằng xyano, flo, clo, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, triflometyl, metoxy hoặc triflometoxy.

Công thức 5-1

A¹ tốt nhất là nito,

R¹ tốt nhất là etyl,

R²-V tốt nhất là vòng từ nhóm Q-42, Q-50, Q-51, Q-52, Q-59 hoặc Q-61,

trong đó,

V tốt nhất là vòng tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phân tử thế giống nhau được lựa chọn từ flo, clo hoặc brom từ nhóm V-82 hoặc V-95,

R³ tốt nhất là hydro,

X tốt nhất là hệ vòng dị vòng thom từ nhóm H20,

R⁵ tốt nhất là triflometyl,

R⁶ tốt nhất là hydro,

R⁷ tốt nhất là metyl,

n tốt nhất là 2.

Công thức 5-2

A¹ tốt nhất là nito,

R¹ tốt nhất là etyl,

R²-V tốt nhất là vòng tùy ý được thế một lần bằng clo hoặc triflometyl từ nhóm Q-12, Q-27, Q-28, Q-42, Q-45, Q-50, Q-51, Q-52, Q-59 hoặc Q-61,

trong đó,

- V tốt nhất là vòng tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ flo, clo hoặc brom từ nhóm V-2, V-82, V-83 hoặc V-95,
- R³ tốt nhất là hydro,
- X tốt nhất là hệ vòng dị vòng thơm từ nhóm H1, H2, H15 hoặc H20,
- R⁵ tốt nhất là triflometyl,
- R⁶ tốt nhất là hydro,
- R⁷ tốt nhất là metyl,
- n tốt nhất là 2.

Theo phương án được nhấn mạnh, R² tùy ý có thể được thế một lần, ngoài với V, bằng clo hoặc triflometyl.

Việc thế ở các vòng từ Q-1 đến Q-80 và tương tự, từ V-1 đến V-101 có thể bằng sự thế hydro tại nguyên tử cacbon và/hoặc tại nguyên tử nitơ.

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H1 và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H2 và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H3 và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, V, X và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H4 và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H5 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H6 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H7 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H8 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H9 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H10 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H11 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1 V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H12 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công

thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H13 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H14 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H15 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H16 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H17 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H18 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H19 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, R^7, A^1, V, X$ và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Theo phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (I) trong đó X là H₂O và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X và n có ý nghĩa như được nêu trong công thức (3-1) hoặc công thức (3-2) hoặc công thức (4-1) hoặc công thức (4-2) hoặc công thức (5-1) hoặc công thức (5-2).

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong các định nghĩa được ưu tiên, trừ khi có quy định khác,

Halogen được lựa chọn từ loạt bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn từ loạt bao gồm flo, clo và brom.

Trong các định nghĩa được ưu tiên đặc biệt, trừ khi có quy định khác,

Halogen được lựa chọn từ loạt bao gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn từ loạt bao gồm flo, clo và brom.

Trong văn cảnh của sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkyl", một mình nó hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ haloalkyl, được hiểu có nghĩa là gốc của nhóm hydrocarbon béo, bão hòa, có 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể là mạch nhánh hoặc không phân nhánh. Ví dụ về các gốc C₁-C₁₂-alkyl là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodexyl. Trong số các gốc alkyl này, được ưu tiên cụ thể là các gốc C₁-C₆-alkyl. Đặc biệt được ưu tiên là các gốc C₁-C₄-alkyl.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkenyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C₂-C₁₂-alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₂-C₆-alkenyl và được ưu tiên cụ thể là các gốc C₂-C₄-alkenyl.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "alkynyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C₂-C₁₂-alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh, có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl.

Trong số này, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -alkynyl và được ưu tiên cụ thể là các gốc C_3 - C_4 -alkynyl. Gốc alkynyl cũng có thể chứa ít nhất một liên kết đôi.

Theo sáng chế, trừ khi có định nghĩa khác ở đâu đó, thuật ngữ "xycloalkyl", một mình hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C_3 - C_8 -xycloalkyl, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -xycloalkyl.

Thuật ngữ "alkoxy", bản thân nó hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ haloalkoxy, được hiểu có nghĩa trong trường hợp này là gốc O-alkyl, trong đó thuật ngữ "alkyl" như được xác định ở trên.

Các gốc được thế halogen, ví dụ, haloalkyl, được halogen hóa một hoặc nhiều lần, lên đến số lượng phần tử thế khả dĩ tối đa. Trong trường hợp halogen hóa nhiều lần, các nguyên tử halogen có thể giống hoặc khác nhau. Trong trường hợp này, halogen là flo, clo, brom hoặc iot, tốt hơn là flo, clo hoặc brom.

Trừ khi có quy định khác, các gốc được thế tùy ý có thể được thế một lần hoặc nhiều lần, trong đó các phần tử thế trong trường hợp thế nhiều lần có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các định nghĩa hoặc giải thích của các gốc nêu trên trong các thuật ngữ chung hoặc trong phạm vi các ưu tiên được áp dụng cho sản phẩm cuối cùng và tương ứng áp dụng cho các nguyên liệu khởi đầu và các chất trung gian. Các định nghĩa về các gốc này có thể kết hợp với các định nghĩa khác nếu muốn, nghĩa là bao gồm các tổ hợp nằm giữa các khoảng được ưu tiên tương ứng.

Được ưu tiên theo sáng chế là việc sử dụng hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp của các nghĩa được liệt kê trên đây làm phương án được ưu tiên.

Được ưu tiên cụ thể theo sáng chế là việc sử dụng hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp của các nghĩa được liệt kê trên đây làm phương án đặc biệt được ưu tiên.

Đặc biệt rất được ưu tiên theo sáng chế là việc sử dụng hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp của các nghĩa được liệt kê trên đây làm phương án đặc biệt rất được ưu tiên.

Được ưu tiên nhất theo sáng chế là việc sử dụng hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp của các nghĩa được liệt kê trên đây làm phương án được ưu tiên nhất.

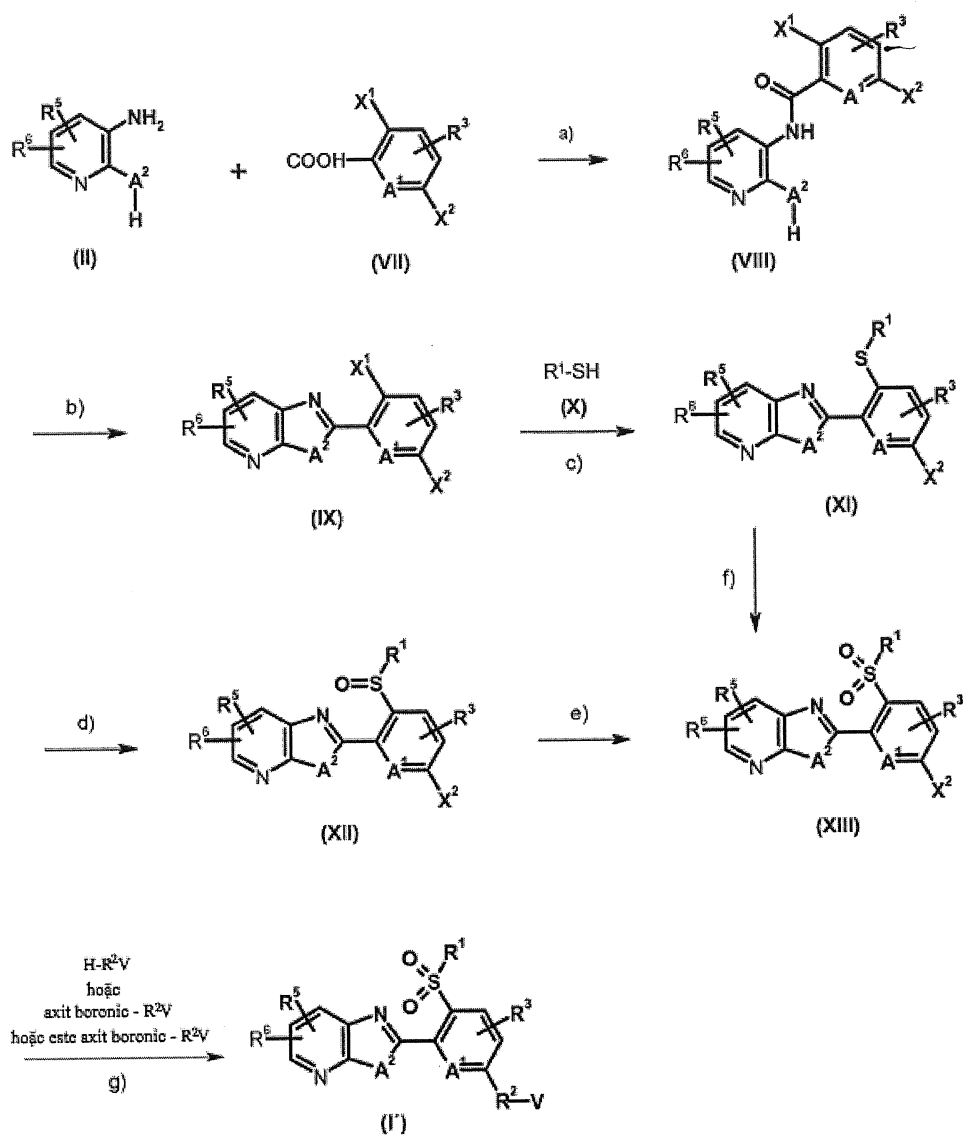
Tùy thuộc vào bản chất của các phần tử thể, hợp chất có công thức (I) có thể ở dạng chất đồng phân hình học và/hoặc chất đồng phân quang hoạt hoặc hỗn hợp đồng phân tương ứng theo các thành phần khác nhau. Ví dụ, các chất đồng phân lập thể này là chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang,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

Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể thu được bằng các quy trình được thể hiện trong các sơ đồ dưới đây:

Quy trình A

Hợp chất có công thức (I) trong đó X là H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 hoặc H20 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 hoặc WO2015/000715.

Quy trình chúng để điều chế hợp chất có công thức (I) trong đó X là H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 hoặc H20 được mô tả dưới đây bằng việc tham chiếu ví dụ H2, H5 và H8.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , A^1 và V có nghĩa như được mô tả ở trên, A^2 là $-N-R^7$, O hoặc S, trong đó R^7 có nghĩa như được mô tả ở trên và X^1 và X^2 là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (VIII) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong US5576335 bằng phản ứng giữa hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (VII) với sự có mặt của chất làm ngưng tụ hoặc bazơ.

Hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/69257 hoặc WO2006/65703.

Axit carboxylic có công thức (VII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2010/234604, WO2012/61926 hoặc Bioorganic và Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

Phản ứng giữa hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (VII) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các chất làm ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, các carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng này. Ưu tiên là sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các hydrocacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Đặc biệt được ưu tiên ở đây là natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydrocacbonat, kali hydrocacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Hợp chất có công thức (IX) có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ hợp chất có công thức (VIII), ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2012/86848.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (IX) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl

metyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện với sự có mặt của chất làm ngưng tụ, axit, bazơ hoặc chất clo hóa.

Ví dụ về các chất làm ngưng tụ thích hợp là các carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; các anhydrit như anhydrit axetic, anhydrit trifloaxetic; hỗn hợp của triphenylfosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp của triphenylfosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

Ví dụ về các axit thích hợp mà có thể được sử dụng trong phản ứng được mô tả là các axit sulfonic như axit para-toluensulfonic; các axit carboxylic như axit axetic, hoặc các axit polyphosphoric.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); các amin bậc ba như trietylamin và N,N-diisopropyletylamin; các bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrua.

Ví dụ về chất clo hóa thích hợp là phospho oxyclorea.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước c)

Hợp chất có công thức (XI) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức (IX) phản ứng với hợp chất có công thức (X) với sự có mặt của bazơ.

Các dẫn xuất mercaptan có công thức (X), ví dụ metyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, hoặc có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329.

Việc chuyển hóa thành hợp chất có công thức (XI) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn

từ các dung môi thông thường mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-methylpyrrolidon hoặc dimetyl sulfoxit.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Được ưu tiên ở đây là xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat. Bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước d)

Hợp chất có công thức (XII) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (XI). Phản ứng oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic hoặc natri periodat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Bước e)

Hợp chất có công thức (XIII) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (XII). Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước f)

Hợp chất có công thức (XIII) cũng có thể được điều chế theo các quy trình một bước bằng cách oxy hóa hợp chất có công thức (XI). Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Được ưu tiên là các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước g)

Việc điều chế hợp chất có công thức (I') trong đó $\text{R}^2\text{-V}$ là vòng hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nitơ có thể diễn ra, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIII) trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu (ví dụ, xem trong tài liệu Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578), ví dụ, với sự có mặt của đồng(I) iodua và các chất phụ gia phản ứng kiềm, ví dụ trans-N,N'-dimethylxyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp.

Hợp chất mong muốn có công thức $\text{H-R}^2\text{V}$ là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết.

Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên là sử dụng toluen. Ngoài ra, phản ứng ghép có thể diễn ra từ hợp chất có công thức (XIII), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm flo, clo hoặc brom, không cần sự xúc tác kim loại với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên ở đây là sử dụng axetonitril hoặc dimethylformamit.

Hợp chất có công thức (I') trong đó R²-V là vòng hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua cacbon có thể được điều chế, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIII) trong đó X² của hợp chất này tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004).

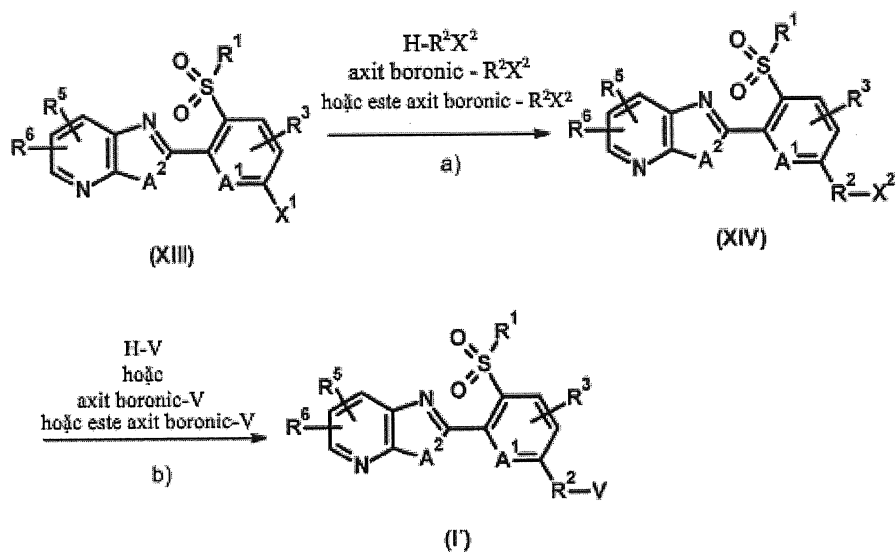
Ví dụ, hợp chất có công thức (XIII) trong đó X² tốt hơn là clo hoặc brom có thể được phản ứng với axit arylboronic thích hợp hoặc các este của nó bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu WO2010071819) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm gồm các muối kim loại chuyển tiếp để tạo ra hợp chất có công thức (I'). Ví dụ về các chất xúc tác kết hợp được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất hỗ trợ phản ứng bazo thích hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình này tốt hơn là các cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết là đã biết và/hoặc có sẵn trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011).

Phản ứng theo bước g) cũng có thể diễn ra khởi đầu từ hợp chất có công thức (XI) hoặc (XII).

Quy trình B

Quy trình chung để điều chế hợp chất có công thức (I) trong đó X là H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 hoặc H20 được mô tả dưới đây bằng việc tham chiếu ví dụ H2, H5 và H8.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , A^1 và V có nghĩa như được mô tả ở trên, A^2 là $-N-R^7$, O hoặc S, trong đó R^7 có nghĩa như được mô tả ở trên và X^1 và X^2 là halogen.

Bước a)

Việc điều chế hợp chất có công thức (XIV) trong đó R^2-X^2 là vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nitơ có thể diễn ra, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIII) trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu (ví dụ, xem trong tài liệu Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578), ví dụ, với sự có mặt của đồng(I) iodua và các chất phụ gia phản ứng kiềm, ví dụ trans-N,N'-dimethylxyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocarbon béo hoặc thơm. Ưu tiên là sử dụng toluen. Ngoài ra, phản ứng ghép có thể diễn ra từ hợp chất có công thức (XIII), trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm flo, clo hoặc brom, không cần sự xúc tác kim loại với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocarbon béo hoặc thơm. Ưu tiên ở đây là sử dụng axetonitril hoặc dimethylformamit.

Hợp chất mong muốn có công thức $H-R^2X^2$ là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết.

Hợp chất có công thức (XIV) trong đó R^2-X^2 là vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua cacbon có thể được điều chế, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIII) trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004).

Ví dụ, hợp chất có công thức (XIII) trong đó X^1 tốt hơn là clo hoặc brom có thể được phản ứng với axit arylboronic thích hợp hoặc các este của nó bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu WO2010071819) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm các muối kim loại chuyển tiếp để tạo ra hợp chất có công thức (XIV). Ví dụ về các chất xúc tác kết hợp được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất hỗ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình này tốt hơn là các cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết là đã biết và/hoặc có sẵn trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011).

Bước b)

Việc điều chế hợp chất có công thức (I') trong đó R^2-V là vòng hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nitơ có thể diễn ra, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIV) trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu (ví dụ, xem trong tài liệu *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578), ví dụ, với sự có mặt của đồng(I) iodua và các chất phụ gia phản ứng kiềm, ví dụ trans-N,N'-dimetylxyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên là sử dụng toluen. Ngoài ra, phản ứng ghép có thể diễn ra từ hợp chất có công thức (XIV), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm flo, clo hoặc brom, không cần sự xúc tác kim loại với sự có mặt của bazơ thích hợp ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi

hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên ở đây là sử dụng axetonitril hoặc dimetylformamit.

Hợp chất mong muốn có công thức H-V là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết.

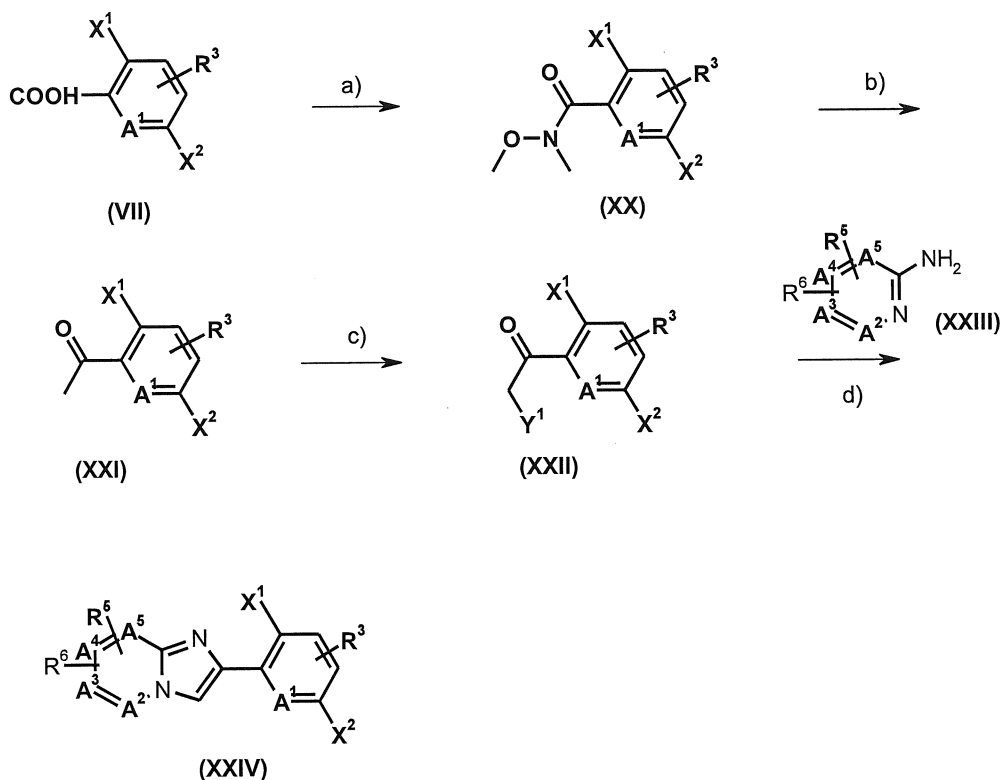
Hợp chất có công thức (I') trong đó R²-V là vòng hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua cacbon có thể được điều chế, ví dụ từ hợp chất có công thức (XIV), trong đó X² tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004).

Ví dụ, hợp chất có công thức (XIV) trong đó X² tốt hơn là clo hoặc brom có thể được phản ứng với axit arylboronic thích hợp hoặc các este của nó bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu WO2010071819) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm các muối kim loại chuyển tiếp để tạo ra hợp chất có công thức (I'). Ví dụ về các chất xúc tác kết hợp được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất hỗ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình này tốt hơn là các cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết là đã biết và/hoặc có sẵn trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết (xem trong tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011).

Quy trình C

Hợp chất có công thức (I) trong đó X là H10, H11, H15 hoặc H16 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298 hoặc *J. Med. Chem.* **31**, (1988) 1590-1595.



Các gốc A^1 , R^3 , R^5 và R^6 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 , X^2 và Y^1 là halogen. A^2 , A^3 , A^4 và A^5 độc lập với nhau là CH hoặc N (trong đó A^2 , A^3 , A^4 và A^5 không đồng thời là N).

Bước a)

Axit carboxylic có công thức (VII) được chuyển đổi tương tự theo quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643 hoặc EP-A-2671582 với sự có mặt của O,N-dimethylhydroxylamin hydroclorua thành amit Weinreb có công thức (XX).

Axit carboxylic có công thức (VII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2010/234604, WO2012/61926 hoặc Bioorganic và Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

Bước b, c)

Sau đó, hợp chất có công thức (XX) có thể được chuyển đổi bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự theo quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643, sử dụng chất phản ứng Grignard ví dụ như metylmagnesium bromua thành keton có công thức (XXI). Quá trình halogen hóa tiếp theo tương tự như các phương pháp đã biết được

mô tả, ví dụ trong tài liệu US2012/302573 hoặc trong tài liệu Eur. J. Org. Chem. 2013, 1551-1557 thu được hợp chất có công thức (XXII).

Bước d)

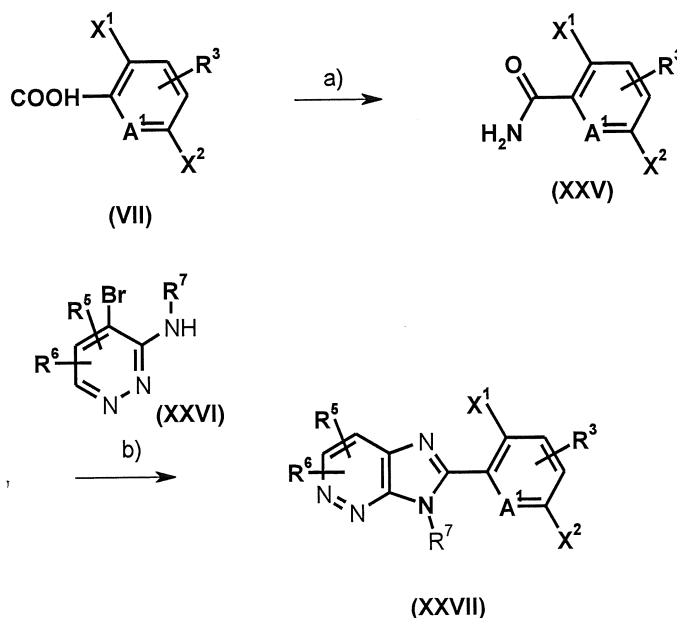
Hợp chất có công thức (XXIV) có thể được điều chế bằng cách khép vòng hợp chất có công thức (XXII) bằng amin có công thức (XXIII). Phản ứng khép vòng được thực hiện, ví dụ trong etanol, axetonitril, cloroform, *tert*-butanol hoặc N,N-dimetylformamit tương tự theo các phương pháp đã biết, ví dụ, theo các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 hoặc J. Med. Chem. **31** (1988) 1590-1595.

Hợp chất có công thức (XXIII) là có sẵn trên thị trường.

Việc chuyển đổi tiếp hợp chất có công thức (XXIV) thành hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự theo các quy trình từ A đến B.

Quy trình D

Hợp chất có công thức (I) trong đó X là H17 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292.



Các gốc A^1 , R^3 , R^5 , R^6 và R^7 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 và X^2 là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (XXV) có thể được điều chế tương tự theo quy trình được mô tả trong tài liệu US5374646 hoặc Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093 - 1096 bằng cách cho hợp chất có công thức (VII) phản ứng với nguồn amoniac với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.

Axit carboxylic có công thức (VII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu US2010/234604, WO2012/61926 hoặc Bioorganic và Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

Phản ứng của hợp chất có công thức (VII) với nguồn amoniac tốt hơn được thực hiện trong dung môi được lựa chọn từ các dung môi thông thường mà các dung môi này trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Tốt hơn là sử dụng ete, ví dụ như dioxan hoặc tetrahydrofuran.

Tác nhân ngưng tụ thích hợp, ví dụ là carbonyldiimidazol.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 70°C.

Bước b)

Hợp chất có công thức (XXVII) có thể được điều chế tương tự theo quy trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292 bằng cách cho hợp chất có công thức (XXV) phản ứng với hợp chất có công thức (XXVI) với sự có mặt của chất xúc tác paladi trong môi trường kiềm.

Hợp chất có công thức (XXVI) có thể được điều chế, ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292. Thích hợp để sử dụng làm chất xúc tác paladi có thể là, ví dụ, [1,1'-bis-(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II). Thường thì kiềm được sử dụng là kiềm vô cơ như kali tert-butoxit.

Phản ứng được thực hiện trong dung môi. Thường sử dụng là toluen.

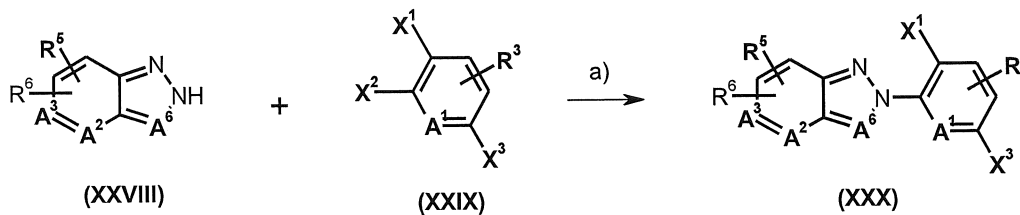
Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 110°C.

Việc chuyển đổi tiếp hợp chất có công thức (XXVII) thành hợp chất có công thức

(I) được thực hiện tương tự theo các quy trình từ A đến B.

Quy trình E

Hợp chất có công thức (I) trong đó X là H3, H12, H13 hoặc H18 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2010/091310, WO 2012/66061 hoặc WO2013/099041.



Các gốc A^1 , R^3 , R^5 và R^6 có nghĩa như được mô tả ở trên. A^2 , A^3 và A^6 độc lập với nhau là CH hoặc N (trong đó, A^2 và A^3 không thể đồng thời là N). X^1 , X^2 và X^3 là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (XXX) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức (XXVIII) phản ứng với hợp chất có công thức (XXIX) thông qua quy trình *N*-aryl hóa xúc tác bằng paladi, ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu *Angewandte Chemie Int. Ed.* 2011, 50, 8944-8947.

Hợp chất có công thức (XXVIII) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2005/100353, WO 2012/66061 hoặc trong tài liệu *European Journal of Medicinal Chemistry* 2010, 45, 2214 - 2222.

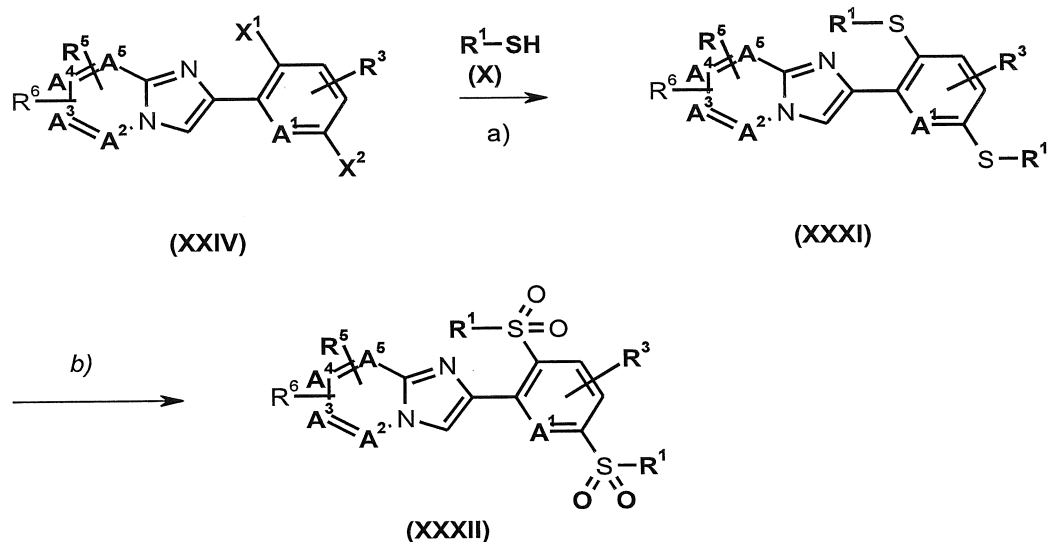
Hợp chất có công thức (XXIX) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2013/43518, EP-A-2168965 hoặc trong tài liệu *Journal of Medicinal Chemistry* 2003, 46, 1449 – 1455.

Việc chuyển đổi thêm hợp chất có công thức (XXX) thành hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự theo các quy trình từ A đến B.

Quy trình F

Hợp chất có công thức (I) trong đó X là H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H14, H15, H16, H17, H19 hoặc H20, theo cách khác có thể được điều chế theo

phương pháp sau. Phương pháp được mô tả dưới đây bằng việc tham chiếu ví dụ H10, H11, H15 và H16.



Các gốc A^1 , R^3 , R^5 và R^6 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 và X^2 là halogen. A^2 , A^3 , A^4 và A^5 độc lập với nhau là CH hoặc N (trong đó A^2 , A^3 , A^4 và A^5 không đồng thời là N).

Bước a)

Tương tự như quy trình A, bước c), disulfit có công thức (XXXI) cũng có thể được tạo ra thay vì sulfit từ hợp chất có công thức (XXIV).

Bước b)

Disulfit có công thức (XXXI) có thể được chuyển đổi tương tự như quy trình A bước f) thành disulfon có công thức (XXXII).

Việc chuyển đổi thêm hợp chất có công thức (XXXII) thành hợp chất có công thức (I) trong đó R^2-V là vòng hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nitơ diễn ra tương tự như quy trình A, bước g) với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp, ví dụ như axetonitril hoặc dimethylformamit.

Các phương pháp và sử dụng

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp kiểm soát động vật gây hại, trong đó, hợp chất có công thức (I) được cho phép tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng. Việc kiểm soát động vật gây hại tốt hơn được tiến hành trong lĩnh vực

nông và lâm nghiệp và trong lĩnh vực bảo vệ vật liệu. Tốt hơn sáng chế loại trừ các phương pháp điều trị ngoại khoa hoặc điều trị bằng thuốc trên cơ thể người hoặc động vật và các phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

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

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

Hợp chất có công thức (I), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật máu nóng và tương thích tốt với môi trường, thích hợp để bảo vệ thực vật và các cơ quan của thực vật chống lại các yếu tố bất lợi sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu sau thu hoạch và để kiểm soát động vật gây hại, nhất là côn trùng, nhện, giun sán, giun tròn và động vật thân mềm, các loại này thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong trồng rừng, trong các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu lưu kho, và trong lĩnh vực vệ sinh.

Theo ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "vệ sinh" được hiểu là có nghĩa toàn bộ tất cả các biện pháp, các quy trình và các thủ tục mà nó nhắm đến để ngăn ngừa các rối loạn – cụ thể là các bệnh nhiễm – và để giúp giữ cho người, động vật và/hoặc môi trường khỏe mạnh và/hoặc để duy trì sạch sẽ. Theo sáng chế, thuật ngữ này bao gồm, cụ thể là, các giải pháp để làm sạch, khử trùng và tiệt trùng, ví dụ, vải dệt hoặc các bề mặt cứng, chủ yếu được làm từ thủy tinh, gỗ, bê tông, sứ, gốm, nhựa hoặc (các) kim loại bất kỳ, và giữ chúng sạch sẽ tránh các loài gây hại làm mất vệ sinh và/hoặc phân của chúng. Trong khía cạnh này, sáng chế loại trừ các quy trình điều trị ngoại khoa hoặc bằng thuốc trên cơ thể người hoặc động vật và quy trình chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Thuật ngữ "khía cạnh vệ sinh" do đó bao gồm tất cả các lĩnh vực, các lĩnh vực kỹ thuật và các ứng dụng thương mại trong đó các biện pháp vệ sinh này, các quy trình và các thủ tục là quan trọng, ví dụ, vệ sinh trong bếp, hiệu bánh, sân bay, nhà tắm, bể bơi, trung tâm mua sắm, khách sạn, bệnh viện, chuồng ngựa, v.v.

Do đó, thuật ngữ "loài gây hại làm mất vệ sinh" được hiểu là một hoặc nhiều động vật gây hại mà sự có mặt của chúng về khía cạnh vệ sinh là có vấn đề, cụ thể là vì các lý

do sức khoẻ. Do đó, mục đích chính là để tối thiểu hóa hoặc ngăn ngừa các loài gây hại làm mất vệ sinh hoặc sự tiếp xúc của chúng trong khía cạnh vệ sinh. Điều này có thể được thực hiện, cụ thể là, bằng cách sử dụng thuốc diệt loài gây hại, trong đó tác nhân này có thể được sử dụng cả về mặt phòng ngừa và chỉ trong trường hợp kiểm soát sự quấy phá của loài gây hại. Cũng có thể sử dụng các chất mà tác động bằng cách tránh hoặc giảm tiếp xúc với loài gây hại. Các loài gây hại làm mất vệ sinh là, ví dụ, các sinh vật được nêu dưới đây.

Do đó, thuật ngữ “bảo vệ vệ sinh” gồm tất cả các hành động mà có tác dụng để duy trì và/hoặc cải thiện các biện pháp, các quy trình và các thủ tục vệ sinh này.

Hợp chất có công thức (I) tốt hơn là có thể được sử dụng làm các chất diệt loài gây hại. Các hợp chất này có hoạt tính chống lại các loài nhện và có tính kháng thuốc thông thường và còn chống lại tất cả hoặc một số giai đoạn phát triển. Các sinh vật gây hại đề cập trên đây bao gồm:

các sinh vật gây hại thuộc ngành chân khớp (Arthropoda), nhất là từ lớp nhện (Arachnida), ví dụ *Acarus* spp., ví dụ *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., ví dụ *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., ví dụ *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., ví dụ *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., ví dụ *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., ví dụ *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., ví dụ *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., ví dụ *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., ví dụ *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*,

Tarsonemus spp., ví dụ *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., ví dụ *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

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

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

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

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

thuộc bộ cánh cứng (Coleoptera), ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alfitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dụ *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Diadraspa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., ví dụ *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberosa*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*,

Heteronychus arator, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., ví dụ *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dụ *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dụ *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., ví dụ *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., ví dụ *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ *Zabrus tenebrioides*;

thuộc bộ cánh da (*Dermaptera*), ví dụ *Anisolabis maritime*, *Forficula auricularia*, *Labidura riparia*;

thuộc bộ hai cánh (*Diptera*), ví dụ *Aedes* spp., ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*,

Calliphora vicina, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., ví dụ *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., ví dụ *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., ví dụ *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., ví dụ *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., ví dụ *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* oder *Pegomyia* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilidae casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiptosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ cánh nửa (Hemiptera), ví dụ *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosceana* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*,

Cacopsylla spp., ví dụ *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp.,
Carneocephala fulgida, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp.,
Chaetosiphon fragaefolii, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*,
Chromaphis juglandicola, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina*
mbila, *Coccoxymytilus halli*, *Coccus* spp., ví dụ *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*,
Coccus pseudomagnoliarum, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp.,
Ctenarytaina spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina*
citri, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., ví dụ
Dysaphis apiifolia, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp.,
Empoasca spp., ví dụ *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca*
solana, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., ví dụ *Eriosoma americanum*, *Eriosoma*
lanigerum, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp.,
Euscelis bilobatus, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*,
Glycaspis spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*,
Hyalopterus arundinis, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., ví dụ *Icerya purchasi*, *Idiocerus*
spp., *Idioscopus* spp., *Laodelfax striatellus*, *Lecanium* spp., ví dụ *Lecanium corni*
(= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., ví dụ *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis*
erysimi, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., ví dụ
Macrosiphum euphorbiae, *Macrosiphum lili*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*,
Mahanarva spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*,
Metopolophium dirhodum, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., ví dụ
Myzus ascalonicus, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*,
Myzus nicotianae, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., ví dụ
Nephotettix cincticeps, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata*
lugens, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp.,
Parabemisia myricae, *Paratrioza* spp., ví dụ *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp.,
Pemphigus spp., ví dụ *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenae*, *Peregrinus maidis*,
Perkinsiella spp., *Phenacoccus* spp., ví dụ *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus*
passerinii, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., ví dụ *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera*
notabilis, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., ví dụ *Planococcus citri*,
Prosopidopsylla flava, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*,
Pseudococcus spp., ví dụ *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*,

Pseudococcus longispinus, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., ví dụ *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., ví dụ *Quadraspidiotus juglansregiae*, *Quadraspidiotus ostreaeformis*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., ví dụ *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., ví dụ *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., ví dụ *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., ví dụ *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

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

thuộc bộ Hymenoptera ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., z.B. *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema (Iridiomyrmex) humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp.,

Technomyrmex albipes, *Urocerus* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

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

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

thuộc bộ Lepidoptera ví dụ *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., ví dụ *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., ví dụ *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., ví dụ *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., ví dụ *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroplote* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuoides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., ví dụ *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp., *Eudocima* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., ví dụ *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., ví dụ *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., ví dụ *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., ví dụ *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homocidus* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., ví dụ *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., ví dụ *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., ví dụ *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., ví dụ

Lyonetia clerkella, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphisa* spp., *Operophtera* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., ví dụ *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., ví dụ *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., ví dụ *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., ví dụ *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., ví dụ *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., ví dụ *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia* bao gồm, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., ví dụ *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., ví dụ *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., ví dụ *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., ví dụ *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stenoma* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

thuộc bộ cánh thẳng (Orthoptera hoặc Saltatoria), ví dụ *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., ví dụ *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., ví dụ *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., ví dụ *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

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

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

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

thuộc bộ Thysanoptera, ví dụ *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Chaetanaphothrips leeuweni*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., ví dụ *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*,

Frankliniella tritici, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Haplothrips* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., ví dụ *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*; thuộc bộ ba đuôi (*Zygentoma*) (= *Thysanura*), ví dụ *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

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

các sinh vật hây hại thuộc ngành thân mềm (*Mollusca*), cụ thể là thuộc lớp hai mảnh vỏ (*Bivalvia*), ví dụ *Dreissena* spp.,

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

các sinh vật ký sinh trên động vật và người thuộc ngành *Platyhelminthes* và *Nematoda*, ví dụ *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp, ví dụ *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., ví dụ *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., ví dụ *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium* spp., ví dụ *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., ví dụ *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus* spp., ví dụ *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., ví dụ *Enterobius vermicularis*, *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., ví dụ *Hymenolepis nana*, *Hyostongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., ví dụ *Loa Loa*, *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocostoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp, ví dụ *Onchocerca volvulus*, *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria*

spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., ví dụ *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., ví dụ *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., ví dụ *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., ví dụ *Trichuris trichuria*, *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp., ví dụ *Wuchereria bancrofti*;

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

Ngoài ra, có thể kiểm soát bộ rệp sáp (Coccidia), ví dụ, *Eimeria* spp. thuộc phân giới của động vật nguyên sinh (Protozoa).

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

Các chế phẩm

Ngoài ra, sáng chế còn đề cập đến công thức phối chế và dạng sử dụng của công thức phối chế này làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ các dung dịch để ngâm, nhúng và phun, chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I). Tùy ý, các dạng sử dụng còn chứa thêm chất diệt sinh vật gây hại và/hoặc chất phụ gia để cải thiện hoạt động, như chất thấm, ví dụ, dầu thực vật, ví dụ dầu hạt cải, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ dầu parafin, alkyl este của axit béo thực vật, ví dụ methyl este của dầu cải dầu hoặc methyl este của dầu đậu nành hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất loang, ví dụ alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng duy trì, ví dụ các polyme của dioctyl sulfosuxinat hoặc hydroxypropylguar và/hoặc chất giữ ẩm, ví dụ glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

Các chế phẩm thường là, ví dụ, chất lỏng hòa tan trong nước (SL), nhũ tương cô đặc (EC), nhũ tương trong nước (EW), huyền phù cô đặc (SC, SE, FS, OD), dạng hạt phân tán trong nước (WG), dạng hạt (GR) và dạng cô đóng nang (CS); các kiểu công thức phối chế này và kiểu công thức phối chế có thể khác được mô tả, ví dụ, trong tài liệu Crop Life International và trong tài liệu Pesticide Specifications, Sổ tay phát triển và sử dụng của FAO và WHO mô tả các thuốc trừ dịch hại, Bài thuyết trình về sản xuất và bảo vệ thực vật của FAO – 173, được chuẩn bị bởi FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Các chế phẩm, ngoài một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I), còn tùy ý bao gồm thêm các hoạt chất hóa nông.

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

Các chế phẩm này được điều chế theo phương thức đã biết, ví dụ bằng cách kết hợp hợp chất có công thức (I) với chất hỗ trợ, ví dụ như, chất độn, dung môi và/hoặc chất mang rắn và/hoặc các chất hỗ trợ khác, ví dụ như, chất hoạt động bề mặt. Các chế phẩm này được sản xuất trong các cơ sở thích hợp hoặc nơi khác trước hoặc trong quá trình ứng dụng.

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

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

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

metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit và dimetyl sulfoxit, và nước.

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

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

Cũng có thể sử dụng các chất độn hoặc dung môi khí hóa lỏng. Đặc biệt thích hợp là các chất độn hoặc chất mang ở trạng thái khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và áp suất khí quyển, ví dụ chất đẩy sol khí như các hydrocacbon được halogen hóa, và cả butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Ví dụ về chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc chất làm ẩm có các đặc tính ion hoặc không ion, hoặc hỗn hợp của các chất hoạt động bề mặt này, đó là các muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulfonic, muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphtalensulfonic, chất đa trùng ngưng của etylen oxit với các rượu béo hoặc với các axit béo hoặc với các amin béo, với các phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulfosuxinic, các dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), các este phosphoric của các rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, các este của axit béo của các polyol, và các dẫn xuất của hợp chất chứa sulfat, sulfonat và phosphat, ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulfonat, alkyl sulfat, arylsulfonat, sản phẩm thủy phân protein, dịch

thải lignosulfit và metylxenluloza. Sự có mặt của chất hoạt động bề mặt là có lợi nếu như một trong số các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một trong số các chất mang trợ không hòa tan được trong nước và khi việc áp dụng diễn ra trong nước.

Các chất phụ trợ khác mà có thể có mặt trong các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này là chất màu như chất màu vô cơ, ví dụ sắt oxit, titan oxit và xanh Prussian, và chất màu hữu cơ như chất màu alizarin, chất màu azo và chất màu kim loại phthaloxyanin, và các chất dinh dưỡng và các vi chất dinh dưỡng như muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molybden và kẽm.

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

Ngoài ra, các chế phẩm và dạng sử dụng thu được từ đó cũng có thể chứa, làm các chất bổ trợ bổ sung, chất kết dính như cacboxymetylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gồm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, hoặc ngoài ra cả các phospholipit tự nhiên như các xephalin và các lecithin và các phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ khác cũng có thể là dầu khoáng hoặc dầu thực vật.

Nếu thích hợp, các chất bổ trợ khác cũng có thể có mặt trong chế phẩm và các dạng sử dụng dẫn xuất từ chúng. Ví dụ về các chất phụ gia như vậy là chất tạo hương, các chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất dính kết, chất cô đặc, chất sol-gel thuận nghịch, chất thấm, chất tăng cường khả năng duy trì, chất ổn định, chất chelat hóa, chất tạo phức, chất giữ ẩm, chất phát tán. Nói chung, hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với chất phụ gia rắn hoặc lỏng bất kỳ thường dùng cho các mục đích phối chế.

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

Chất thấm thích hợp trong bối cảnh sáng chế này là tất cả các chất thường được sử dụng để cải thiện tính thấm của các hoạt chất hóa nông vào trong thực vật. Các chất thấm được xác định trong ngữ cảnh này bằng khả năng thấm của chúng từ chất lỏng áp dụng (thường ở dạng nước) và/hoặc từ lớp phun phủ vào trong biểu bì của thực vật và do đó

làm tăng khả năng di chuyển của hoạt chất trong biểu bì. Phương pháp mô tả trong tài liệu (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác định đặc tính này. Các ví dụ bao gồm rượu alkoxylat như etoxylat béo của dừa (10) hoặc isotridexyl etoxylat (12), este axit béo, ví dụ metyl este dầu hạt cải hoặc metyl este dầu đậu nành, alkoxylat amin béo, ví dụ tallowamin etoxylat (15), hoặc các muối amoni và/hoặc phosphoni, ví dụ amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat.

Tốt hơn nếu các chế phẩm này chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 98% trọng lượng, tốt hơn nữa là với lượng từ 0,01% đến 95% trọng lượng, tốt nhất là với lượng từ 0,5% đến 90% trọng lượng so với trọng lượng của chế phẩm.

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

Hỗn hợp

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp cùng với một hoặc nhiều chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt loài nhuyễn thể, chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, vi sinh vật, sinh vật có lợi, chất diệt cỏ, phân bón, chất xua đuổi chim, chất bổ dưỡng thực vật, chất tiết trùng, chất an toàn, chất truyền tín hiệu và/hoặc chất điều hòa sinh trưởng thực vật thích hợp, bằng cách đó, ví dụ, để mở rộng phổ tác động, để kéo dài thời gian tác động, để gia tăng tỷ lệ tác động, để ngăn chặn sự đẩy ngược hoặc ngăn chặn sự phát triển tính kháng. Ngoài ra, các hỗn hợp hoạt chất thuộc loại này có thể giúp cải thiện sức sinh trưởng của thực vật và/hoặc khả năng chịu được các yếu tố phi sinh học, ví dụ nhiệt độ cao hoặc thấp, khả năng chịu được hạn hán hoặc chịu được hàm lượng nước hoặc độ mặn của đất tăng cao. Cũng có thể cải thiện đặc tính trổ hoa và kết trái, tối ưu hóa khả năng nảy mầm và phát triển rễ, tạo thuận lợi cho việc thu hoạch và cải thiện năng suất, tác động lên quá trình chín, cải thiện chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của các sản phẩm thu hoạch, kéo dài thời gian bảo quản và/hoặc cải thiện khả năng xử lý của các sản phẩm thu hoạch.

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

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

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

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

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

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), ví dụ như, các loại carbamat, ví dụ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các phosphat hữu cơ, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, diclofos/DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalfos, sulfotep,

tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

(2) Các chất đối kháng kênh clorua qua cổng GABA, ví dụ, các xyclodien-clo hữu cơ, ví dụ, chlordane và endosulfan hoặc các phenylpyrazol (các fiprol), ví dụ ethiprol và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri/các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ các pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin s-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alfa-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, chất đồng phân cyphenothrin [(1R)-trans], deltamethrin, chất đồng phân empenethrin [(EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momfloethrin, permethrin, phenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], prallethrin, các pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [(chất đồng phân (1R))], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxychlor.

(4) Các chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic axetylcholine receptor - nAChR) ví dụ, các neonicotinoid, ví dụ, acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam hoặc nicotin hoặc sulfoxaflor hoặc flupyradifuron.

(5) Các chất hoạt hóa dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic axetylcholine receptor - nAChR), ví dụ, các spinosyn, ví dụ, spinetoram và spinosad.

(6) Các chất hoạt hóa kênh clorua, ví dụ, các avermectin/các milbemycin, ví dụ, abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất bắt chước hormon ấu trùng, ví dụ, các chất tương tự hormon ấu trùng, ví dụ, hydroprene, kinoprene và methoprene hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các hoạt chất không rõ cơ chế tác động hoặc có cơ chế tác động không đặc hiệu, ví dụ

các alkyl halogenua, ví dụ, methyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc chloropicrin hoặc sulfuric florua hoặc chất gây nôn borax hoặc tartar.

- (9) Các chất gây chán ăn chọn lọc, ví dụ, pymetrozin hoặc flonicamid.
- (10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét, ví dụ, clofentezin, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.
- (11) Các chất phá vỡ vi sinh vật ở màng ruột côn trùng, ví dụ *Bacillus thuringiensis* loài phụ *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *tenebrionis*, và các protein thực vật BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- (12) Các chất ức chế quá trình phosphoryl hóa oxy hóa, các chất phá hủy ATP, ví dụ, diafenthiuron hoặc các hợp chất cơ thiếc, ví dụ, azoxyclofen, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargite hoặc tetradifon.
- (13) Các chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa làm gián đoạn quá trình gradien proton H, ví dụ, chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.
- (14) Các chất đối kháng thụ thể axetylcholin nicotinergeric, ví dụ, bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.
- (15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 0, ví dụ, bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclofenuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.
- (16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 1, ví dụ, buprofezin.
- (17) Các chất ức chế quá trình lột xác (nhất là đối với Diptera (bộ côn trùng hai cánh), tức là, các côn trùng hai cánh (dipteran), ví dụ, cyromazin.
- (18) Các chất chủ vận thụ thể hormon kích thích trưởng thành và lột xác (Ecdyson), ví dụ, chromafenozid, halofenozid, metoxyfenozid và tebufenozid.
- (19) Các chất chủ vận octopaminergic, ví dụ, amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-III, ví dụ, hydrametylnon; hoặc acequinocyl hoặc fluacrypyrim.
- (21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức - I, ví dụ, các chất diệt ve bét METI, ví dụ, fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenon (Derris).

(22) Các chất phong bế kênh natri đóng mở theo điện thế, ví dụ indoxacarb hoặc metaflumizon.

(23) Các chất ức chế men axetyl-CoA cacboxylaza, ví dụ, tetronic và các dẫn xuất axit tetramic, ví dụ, spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-IV ví dụ, các phosphin, ví dụ, nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua hoặc xyanua.

(25) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức-II, ví dụ, xyenopyrafen và xyflumetofen.

(28) Các chất tác động lên thụ thể ryanodin, ví dụ diamit, ví dụ, clorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit,

Các hoạt chất khác có cơ chế hoạt động chưa biết hoặc chưa rõ ràng, ví dụ afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclothiaz, benzoximat, bifenazat, broflanilid, bromopropylat, quinomethionate, cryolite, cyclaniliprol, xycloxaprid, cyhalodiamid, dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazin, flometoquin, fluazaindolizin, fluensulfon, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprol, fluhexafon, fluopyram, fluralaner, fluxametamid, fufenozid, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodion, lotilaner, meperfluthrin, paichongding, pyflubumid, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, sarolaner, tetrametylfluthrin, tetraniliprol, tetrachlorantraniliprol, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim và iodometan; và các dạng điều chế bổ sung dựa trên *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và các hoạt chất đã biết dưới đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazole-5-amin (đã biết từ WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)methanone (đã biết từ WO2003/106457), 2-clo-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamide (đã biết từ WO2006/003494), 3-(2,5-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết từ WO2009/049851), 3-(2,5-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yletyl cacbonat (đã biết từ WO2009/049851), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl-piperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết từ WO2004/099160), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3-clophenyl)pyrimidin (đã biết từ WO2003/076415), PF1364 (CAS Reg.No. 1204776-60-2), metyl 2-[2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)-5-clo-3-metylbenzoyl]-2-metylhydrazinecarboxylate (đã biết trong tài liệu

WO2005/085216), methyl 2-[2-([3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl)amino]-5-cyano-3-methylbenzoyl]-2-ethylhydrazinecarboxylate (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), methyl 2-[2-([3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl)amino]-5-cyano-3-methylbenzoyl]-2-methylhydrazinecarboxylate (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), methyl 2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl)amino]benzoyl]-2-ethylhydrazinecarboxylate (đã biết trong tài liệu WO2005/085216), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-methylfenyl]-3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazole-5-carboxamide (đã biết trong tài liệu CN102057925), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-5-(triflometyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-2-methyl-N-(1-oxidothietan-3-yl)benzamide (đã biết trong tài liệu WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-ylidene]-2,2,2-trifloacetamide (đã biết trong tài liệu WO2012/029672), 1-[(2-clo-1,3-thiazol-5-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olate (đã biết trong tài liệu WO2009/099929), 1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-4-oxo-3-phenyl-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olate (đã biết trong tài liệu WO2009/099929), 4-(3-{2,6-diclo-4-[(3,3-dicloprop-2-en-1-yl)oxy]phenoxy}propoxy)-2-metoxi-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biết trong tài liệu CN101337940), N-[2-(tert-butylcarbamoil)-4-clo-6-methylfenyl]-1-(3-clopyridin-2-yl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazole-5-carboxamide (đã biết trong tài liệu WO2008/134969, butyl [2-(2,4-diclophenyl)-3-oxo-4-oxaspiro[4.5]dec-1-en-1-yl]cacbonat (đã biết trong tài liệu CN 102060818), 3E)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridylidene]-1,1,1-triflopropan-2-on (đã biết trong tài liệu WO2013/144213, N-(metylsulfonyl)-6-[2-(pyridin-3-yl)-1,3-thiazol-5-yl]pyridin-2-carboxamide (đã biết trong tài liệu WO2012/000896), N-[3-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentaflaoetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide (đã biết trong tài liệu WO2010/051926), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(methylcarbamoil)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazole-3-carboxamide (đã biết trong tài liệu CN103232431).

Các chất diệt nấm

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

Tất cả các thành phần kết hợp diệt nấm được liệt kê trong các nhóm từ (1) đến (15) có thể tùy ý tạo thành các muối với các bazơ hoặc axit tương ứng nếu các nhóm chức thích hợp là có mặt. Ngoài ra, các thành phần kết hợp diệt nấm được liệt kê trong các nhóm từ (1) đến (15) cũng bao gồm các dạng hỗn biến nếu có hiện tượng hỗn biến.

1) các chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.01) aldimorph, (1.02) azaconazole, (1.03) bitertanol, (1.04) bromuconazole, (1.05) cyproconazole, (1.06) diclobutrazole, (1.07) difenoconazole, (1.08) diniconazole, (1.09) diniconazole-M, (1.10) dodemorph, (1.11) dodemorph axetat, (1.12) epoxiconazole, (1.13) etaconazole, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazole, (1.16) fenhexamide, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorph, (1.19) fluquinconazole, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazole, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazole, (1.24) furconazole-cis, (1.25) hexaconazole, (1.26) imazalil, (1.27) imazalil sulfate, (1.28) imibenconazole, (1.29) ipconazole, (1.30) metconazole, (1.31) myclobutanil, (1.32) naftifine, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazole, (1.35) paclobutrazole, (1.36) pefurazoate, (1.37) penconazole, (1.38) piperalin, (1.39) prochloraz, (1.40) propiconazole, (1.41) prothioconazole, (1.42) pyributicarb, (1.43) pyrifenox, (1.44) quinconazole, (1.45) simeconazole, (1.46) spiroxamine, (1.47) tebuconazole, (1.48) terbinafin, (1.49) tetraconazole, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorph, (1.53) triflumizole, (1.54) triforin, (1.55) triticonazole, (1.56) uniconazole, (1.57) uniconazole-p, (1.58) viniconazole, (1.59) voriconazole, (1.60) 1-(4-clophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)xyloheptanol, (1.61) metyl ester của axit 1-(2,2-dimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylic, (1.62) N'-{5-(diflometyl)-2-metyl-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.63) N-etyl-N-metyl-N'-{2-metyl-5-(triflometyl)-4-[3-(trimetylsilyl)propoxy]phenyl}imidoformamit, (1.64) O-[1-(4-metoxypheoxy)-3,3-dimetylbutan-2-yl]-1H-imidazol-1-carbothioate, (1.65) pyrisoxazole, (1.66) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.67) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-ylthiocyanate, (1.68) 5-(allylsulfanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazole, (1.69) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.70) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.71) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-

diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.72) 1-
 {[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol-5-
 ylthiocyanate, (1.73) 1- {[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-
 yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol-5-ylthiocyanate, (1.74) 5-(allylsulfanyl)-1- {[rel(2R,3S)-3-(2-
 clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazole, (1.75) 5-
 (allylsulfanyl)-1- {[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-
 1H-1,2,4-triazole, (1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-
 trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-
 (2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-
 3-thione, (1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-
 yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-
 hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.80) 2-
 [(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-
 1,2,4-triazole-3-thione, (1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-
 trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-
 (2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-
 3-thione, (1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-
 yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazole-3-thione, (1.84) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-
 (triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.85) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-
 (triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.86) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-
 (triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.87) 2-[2-clo-4-(4-
 clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.88) 2-[2-clo-4-(2,4-
 diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.89) (2R)-2-(1-
 cloxyclopropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol,
 (1.90) (2R)-2-(1-cloxyclopropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
 yl)butan-2-ol, (1.91) (2S)-2-(1-cloxyclopropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxyclopropyl]-1-(1H-
 1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.92) (2S)-2-(1-cloxyclopropyl)-4-[(1R)-2,2-
 dicloxyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-
 clobenzyl)-2-(clometyl)-2-methyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)xylopentanol, (1.94)
 (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-methyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
 ylmethyl)xylopentanol, (1.95) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-methyl-1-(1H-1,2,4-
 triazol-1-ylmethyl)xylopentanol.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức I hoặc II, ví dụ (2.01) bixafen, (2.02) boscalid, (2.03) carboxin, (2.04) diflumetorim, (2.05) fenfuram, (2.06) fluopyram, (2.07) flutolanil, (2.08) fluxapyroxad, (2.09) furametpyr, (2.10) furmexyclox, (2.11) isopyrazam (hỗn hợp của chất triệt quang epime dạng syn 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang epime dạng anti 1RS,4SR,9SR), (2.12) isopyrazam (chất triệt quang epime dạng anti 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime dạng anti 1R,4S,9S), (2.14) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime dạng anti 1S,4R,9R), (2.15) isopyrazam (chất triệt quang epime dạng syn 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime dạng syn 1R,4S,9R), (2.17) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh epime dạng syn 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxycarboxin, (2.20) penflufen, (2.21) penhiopyrad, (2.22) sedaxane, (2.23) thifluzamide, (2.24) 1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]-3-(triflometyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.25) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.26) 3-(diflometyl)-N-[4-flo-2-(1,1,2,3,3,3-hexaflopropoxy)phenyl]-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.27) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.28) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.29) benzovindiflupyr, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclometylene)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methanonaphthalin-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclometylene)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methanonaphthalin-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.32) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.33) 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.34) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.35) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.36) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.37) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.38) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.39) 1,3,5-trimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.40) 1,3,5-trimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.41) benodanil, (2.42) 2-clo-N-(1,1,3-

trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridin-3-carboxamide, (2.43) isofetamid, (2.44) 1-methyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.45) N-(4'-clobiphenyl-2-yl)-3-(diflometyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.46) N-(2',4'-diclobiphenyl-2-yl)-3-(diflometyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.47) 3-(diflometyl)-1-methyl-N-[4'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.48) N-(2',5'-diflobiphenyl-2-yl)-1-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.49) 3-(diflometyl)-1-methyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.50) 5-flo-1,3-dimethyl-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.51) 2-clo-N-[4'-(prop-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (2.52) 3-(diflometyl)-N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.53) N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-5-flo-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.54) 3-(diflometyl)-N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.55) N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)-5-flo-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.56) 2-clo-N-(4'-ethynylbiphenyl-2-yl)nicotinamide, (2.57) 2-clo-N-[4'-(3,3-dimethylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (2.58) 4-(diflometyl)-2-methyl-N-[4'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1,3-thiazole-5-carboxamide, (2.59) 5-flo-N-[4'-(3-hydroxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.60) 2-clo-N-[4'-(3-hydroxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (2.61) 3-(diflometyl)-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.62) 5-flo-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.63) 2-clo-N-[4'-(3-methoxy-3-methylbut-1-yn-1-yl)biphenyl-2-yl]nicotinamide, (2.64) 1,3-dimethyl-N-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.65) 1,3-dimethyl-N-[(3R)-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.66) 1,3-dimethyl-N-[(3S)-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.67) 3-(diflometyl)-N-methoxy-1-methyl-N-[1-(2,4,6-triclophenyl)propan-2-yl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.68) 3-(diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.69) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2.70) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide.

- 3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức III, ví dụ (3.01) ametoctradin, (3.02) amisulbrom, (3.03) azoxystrobin, (3.04) cyazofamid, (3.05) coumetoxystrobin, (3.06) coumoxystrobin, (3.07) dimoxystrobin, (3.08) enoxastrobin, (3.09) famoxadon, (3.10) fenamidon, (3.11) flufenoxystrobin, (3.12) fluoxastrobin, (3.13) kresoxim-metyl, (3.14) metominostrobin, (3.15) orysastrobin, (3.16) picoxystrobin, (3.17) pyraclostrobin, (3.18) pyrametostrobin, (3.19) pyraoxystrobin, (3.20) pyribencarb, (3.21) triclopyricarb, (3.22) trifloxystrobin, (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-clo-2-metylphenoxy)-5-flopyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(metoxyimino)-N-metylacetamide, (3.24) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-(2-{[(1E)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden}amino)oxy]metyl}phenyl)acetamide, (3.25) (2E)-2-(metoxyimino)-N-metyl-2-{2-[(E)-{1-[3-(triflometyl)phenyl]etoxy}imino)metyl]phenyl}acetamide, (3.26) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metylacetamide, (3.27) fenaminostrobin, (3.28) 5-metoxy-2-metyl-4-(2-{[(1E)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden}amino)oxy]metyl}phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on, (3.29) metyl este của axit (2E)-2-{2-[(cyclopropyl[(4-metoxyphenyl)imino]metyl}sulfanyl)metyl]phenyl}-3-metoxyacrylic, (3.30) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamide, (3.31) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxy-N-metylacetamide, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxy-N-metylacetamide, (3.33) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamide.
- 4) Các chất ức chế sự phân bào nguyên nhiễm và phân chia tế bào, ví dụ (4.01) benomyl, (4.02) carbendazim, (4.03) clofenazol, (4.04) diethofencarb, (4.05) ethaboxam, (4.06) fluopicolide, (4.07) fuberidazol, (4.08) pencycuron, (4.09) thiabendazol, (4.10) thiophanat-metyl, (4.11) thiophanat, (4.12) zoxamit, (4.13) 5-clo-7-(4-metylpiiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin, (4.14) 3-clo-5-(6-clopyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflophenyl)pyridazin.
- 5) Các hợp chất có khả năng có hoạt tính ở nhiều vị trí, ví dụ (5.01) hỗn hợp Bordeaux, (5.02) captafol, (5.03) captan, (5.04) chlorothalonil, (5.05) đồng hydroxit, (5.06) đồng naphtenat, (5.07) đồng oxit, (5.08) đồng oxyclorea, (5.09) đồng(2+) sulfat, (5.10) diclofluanid, (5.11) dithianon, (5.12) dodin, (5.13) bazơ tự do dodin, (5.14) ferbam, (5.15) flofolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatin, (5.18) guazatin axetat, (5.19) iminoctadin, (5.20)

iminocadin albesilat, (5.21) iminocadin triaxetat, (5.22) mandong, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram kẽm, (5.27) oxin-đồng, (5.28) propamidin, (5.29) propineb, (5.30) lưu huỳnh và chế phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.31) thiram, (5.32) tolylfluanid, (5.33) zineb, (5.34) ziram, (5.35) anilazin.

6) Các hợp chất có khả năng cảm ứng sự phòng vệ của vật chủ, ví dụ (6.01) acibenzolar-S-metyl, (6.02) isotianil, (6.03) probenazole, (6.04) tiadinil, (6.05) laminarin.

7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.01) andoprim, (7.02) blasticidin-S, (7.03) cyprodinil, (7.04) kasugamycin, (7.05) kasugamycin hydroclorua hydrate, (7.06) mepanipyrim, (7.07) pyrimethanil, (7.08) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetramethyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinoline, (7.09) oxytetracycline, (7.10) streptomycin.

8) Các chất ức chế sản xuất ATP, ví dụ (8.01) fentin axetat, (8.02) fentin clorua, (8.03) fentin hydroxit, (8.04) silthiofam.

9) Các chất ức chế sự tổng hợp vách tế bào, ví dụ (9.01) benthiavalicarb, (9.02) dimethomorph, (9.03) flumorph, (9.04) iprovalicarb, (9.05) mandipropamid, (9.06) polyoxins, (9.07) polyoxorim, (9.08) validamycin A, (9.09) valifenalate, (9.10) polyoxin B, (9.11) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.12) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.

10) Các chất ức chế sự tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.01) biphenyl, (10.02) cloneb, (10.03) dicloran, (10.04) edifenphos, (10.05) etridiazol, (10.06) iodocarb, (10.07) iprobenfos, (10.08) isoprothiolan, (10.09) propamocarb, (10.10) propamocarb hydroclorua, (10.11) prothiocarb, (10.12) pyrazophos, (10.13) quintozen, (10.14) tecnazen, (10.15) tolclofos-metyl.

11) Các chất ức chế sự sinh tổng hợp melanin, ví dụ (11.01) carpropamid, (11.02) diclocymet, (11.03) fenoxanil, (11.04) phthalogenua, (11.05) pyroquilon, (11.06) tricyclazole, (11.07) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamate.

12) Các chất ức chế sự tổng hợp axit nucleic, ví dụ (12.01) benalaxyl, (12.02) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.03) bupirimate, (12.04) clozylacon, (12.05) dimethirimol, (12.06) ethirimol, (12.07) furalaxyl, (12.08) hymexazol, (12.09) metalaxyl, (12.10) metalaxyl-M

(mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixyl, (12.13) axit oxolinic, (12.14) othilinone.

13) Các chất ức chế sự truyền tín hiệu, ví dụ (13.01) chlozolate, (13.02) fenpiclonil, (13.03) fludioxonil, (13.04) iprodione, (13.05) procymidone, (13.06) quinoxifen, (13.07) vinclozolin, (13.08) proquinazid.

14) Các chất có khả năng hoạt động làm các chất khử liên hợp, ví dụ (14.01) binapacryl, (14.02) dinocap, (14.03) ferimzone, (14.04) fluazinam, (14.05) meptyldinocap.

15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.001) benthiazole, (15.002) bethoxazin, (15.003) capsimycin, (15.004) carvone, (15.005) quinomethionate, (15.006) pyriofenone (chlazafenone), (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamide, (15.011) dazomet, (15.012) debacarb, (15.013) diclophen, (15.014) diclomezin, (15.015) difenzoquat, (15.016) difenzoquat metilsulfate, (15.017) diphenylamine, (15.018) Ecomate, (15.019) fenpyrazamine, (15.020) flumetover, (15.021) floimide, (15.022) flusulfamide, (15.023) flutianil, (15.024) fosetyl-aluminium, (15.025) fosetyl-calcium, (15.026) fosetyl-natri, (15.027) hexaclobenzen, (15.028) irumamycin, (15.029) methasulfocarb, (15.030) metyl isothiocyanate, (15.031) metrafenone, (15.032) mildiomyacin, (15.033) natamycin, (15.034) niken dimetyldithiocarbamate, (15.035) nitrothal-isopropyl, (15.036) oxamocarb, (15.037) oxyfenthin, (15.038) pentaclophenol và các muối, (15.039) phenothrin, (15.040) axit phosphor và muối của nó, (15.041) propamocarb-fosetilate, (15.042) propanosin-natri, (15.043) pyrimorph, (15.044) pyrrolnitrin, (15.045) tebufloquin, (15.046) tecloftalam, (15.047) tolifenid, (15.048) triazoxide, (15.049) trichlamid, (15.050) zarilamid, (15.051) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)methoxy]-4-methoxypyridin-2-yl)carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl este của axit 2-methylpropanoic, (15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanone, (15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanone, (15.054) oxathiapiroline, (15.055) 1-(4-methoxyphenoxy)-3,3-dimethylbutan-2-yl este của axit 1H-imidazol-1-carboxylic, (15.056) 2,3,5,6-tetraclo-4-(metylsulfonyl)pyridin, (15.057) 2,3-dibutyl-6-clothieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-on, (15.058) 2,6-dimetyl-

1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrole-1,3,5,7(2H,6H)-tetrone, (15.059) 2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5R)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)ethanone, (15.060) 2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-(4-{4-[(5S)-5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)ethanone, (15.061) 2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-{4-[4-(5-phenyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl)-1,3-thiazol-2-yl]piperidin-1-yl}ethanone, (15.062) 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-on, (15.063) 2-clo-5-[2-clo-1-(2,6-diflo-4-metoxypheyl)-4-metyl-1H-imidazol-5-yl]pyridin, (15.064) 2-phenylfenol và các muối, (15.065) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinoline, (15.066) axit 3,4,5-triclopyridin-2,6-dicarboxylic nitril, (15.067) 3-clo-5-(4-clophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-6-metylpyridazine, (15.068) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimetylpyridazine, (15.069) 5-amino-1,3,4-thiadiazole-2-thiol, (15.070) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-in-1-yl)thiophene-2-sulfonohydrazide, (15.071) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amine, (15.072) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.073) 5-metyl-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin, (15.074) etyl este axit (2Z)-3-amino-2-cyano-3-phenylacrylic, (15.075) N'-(4-{[3-(4-clobenzyl)-1,2,4-thiadiazol-5-yl]oxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.076) N-(4-clobenzyl)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-yloxy)phenyl]propanamide, (15.077) N-[(4-clophenyl)(cyano)metyl]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-yloxy)phenyl]propanamide, (15.078) N-[(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)metyl]-2,4-diclonicotinamide, (15.079) N-[1-(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)etyl]-2,4-diclonicotinamide, (15.080) N-[1-(5-bromo-3-clopyridin-2-yl)etyl]-2-flo-4-iodonicotinamide, (15.081) N-{(E)-[(xyclopropylmetoxy)imino][6-(diflometoxy)-2,3-diflophenyl]metyl}-2-phenylacetamide, (15.082) N-{(Z)-[(xyclopropylmetoxy)imino][6-(diflometoxy)-2,3-diflophenyl]metyl}-2-phenylacetamide, (15.083) N'-{4-[(3-tert-butyl-4-cyano-1,2-thiazol-5-yl)oxy]-2-clo-5-metylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.084) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalin-1-yl)-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.085) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalin-1-yl]-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.086) N-metyl-2-(1-{[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalin-1-yl]-1,3-thiazole-4-carboxamide, (15.087) pentyl este axit {6-

[({[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamic, (15.088) axit phenazine-1-carboxylic, (15.089) quinolin-8-ol, (15.090) quinolin-8-ol sulfate (2:1), (15.091) tert-butyl este axit {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamic, (15.092) (5-bromo-2-metoxi-4-metylpyridin-3-yl)(2,3,4-trimetoxi-6-metylphenyl)methanone, (15.093) N-[2-(4-{[3-(4-clophenyl)prop-2-yn-1-yl]oxy}-3-metoxi-phenyl)etyl]-N2-(metylsulfonyl)valinamide, (15.094) 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic acid, (15.095) but-3-yn-1-yl este axit {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamic, (15.096) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng hồ biến: propyl este axit 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.097) 3,4,5-trihydroxybenzoic, (15.098) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.099) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.100) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (15.101) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamide, (15.102) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazoline, (15.103) 2-[6-(3-flo-4-metoxi-phenyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazoline, (15.104) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinoline, (15.105) axit abscisic, (15.106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.107) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.108) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.109) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxi]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.110) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.111) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.112) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.113) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.114) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.115) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.116) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.117) N-

xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-
 carboxamide, (15.118) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-
 1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.119) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-
 flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.120) N-(2-
 xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-
 carboxamide, (15.121) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-
 1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.122) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-
 5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.123) N-xyclopropyl-3-
 (diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide,
 (15.124) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-
 metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.125) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-
 xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.126) N-[5-
 clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-
 carboxamide, (15.127) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-
 (triflometyl)benzyl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.128) N-[2-clo-6-
 (triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-
 carboxamide, (15.129) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-
 (diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (15.130) N-xyclopropyl-3-
 (diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazole-4-carboxamide,
 (15.131) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-
 pyrazole-4-carbothioamide, (15.132) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-
 metylimidoformamit, (15.133) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-
 dimetylfenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (15.134) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-
 clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.135) 9-flo-2,2-dimetyl-5-
 (quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepine, (15.136) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-
 metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.137) 2-{2-[(7,8-diflo-2-metylquinolin-
 3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol, (15.138) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-
 dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.139) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-
 dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.140) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-
 dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.141) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-
 1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.142) N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-
 flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.143) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-

bromophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.144) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.145) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.146) N-(2-bromophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.147) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.148) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.149) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amine, (15.150) N'-(4-{3-[(diflometyl)sulfanyl]phenoxy}-2,5-dimethylfenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.151) N'-(2,5-dimethyl-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.152) N'-(2,5-dimethyl-4-{3-[(2,2,2-trifloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.153) N'-(2,5-dimethyl-4-{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.154) N'-(2,5-dimethyl-4-{3-[(pentafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.155) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimethylfenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.156) N'-(2,5-dimethyl-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.157) N'-(2,5-dimethyl-4-{[3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.158) N'-(2,5-dimethyl-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.159) N'-(2,5-dimethyl-4-{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (15.160) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.161) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.162) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.163) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenylmetansulfonate, (15.164) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenylmetansulfonate, (15.165) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-

{(5S)-5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.166) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.167) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.168) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.169) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.170) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]ethanone, (15.171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenylmetansulfonate, (15.172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenylmetansulfonate, (15.173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenylmetansulfonate, (15.174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenylmetansulfonate.

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

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

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

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

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

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

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

Beauveria bassiana, cụ thể là chủng ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, cụ thể là chủng CON/M/91-8 (Mã số truy cập DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, cụ thể là chủng HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*), cụ thể là chủng KV01, *Metarhizium anisopliae*, cụ thể là chủng F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, cụ thể là chủng NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (mới: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (Mã truy cập số ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* chủng 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, đặc biệt là chủng V117b, *Trichoderma atroviride*, đặc biệt là chủng SC1 (Mã truy cập số CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum* rifai T39 (Mã truy cập số CNCM I-952).

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

Virus hạt (*granulosis virus* - GV) tác động lên *Adoxophyes orana* (bướm sâu cuốn lá ở cây ăn quả mùa hè), virus hạt (*granulosis virus* - GV) tác động lên *Cydia pomonella* (ấu trùng sâu bướm), virus đa diện nhân (*nuclear polyhedrosis virus* - NPV) tác động lên

Helicoverpa armigera (giun nang ở bông), mNPV tác động lên *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng), mNPV tác động lên *Spodoptera frugiperda* (sâu xanh mùa thu), NPV tác động lên *Spodoptera littoralis* (sâu ăn lá bông châu Phi).

Cũng bao gồm vi khuẩn và nấm, các loại này được bổ sung làm 'chất để cây' lên thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc các cơ quan của thực vật và, nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ có thể được kể đến là:

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

Ví dụ về các chất chiết từ thực vật và các sản phẩm tạo ra bởi vi sinh vật bao gồm cả các protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học đó là:

Allium sativum, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (chất chiết saponin từ cây *Chenopodium quinoa*), Pyrethrum/Pyrethrins, Quassia amara, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "chất diệt côn trùng Requiem™", rotenone, ryania/ryanodine, *Symphitum officinale*, *Tanacetum vulgare*, thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, chất chiết Brassicaceae, đặc biệt là bột hạt cải dầu hoặc bột mù tạt.

Chất an toàn làm thành phần phối trộn

Hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với chất an toàn, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulamid, dichlormid, fenchlorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphthalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoil)amino]phenyl}sulfonyl)-benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả thực vật và các bộ phận của thực vật có thể được xử lý theo sáng chế Ở đây, thực vật được hiểu có nghĩa là toàn bộ thực vật và nhóm thực vật, như thực vật hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm cây trồng xuất hiện tự nhiên), ví dụ ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, ớt chuông và ớt, dưa chuột, dưa, carot, dưa hấu, hành, rau diếp, rau bina, tỏi tây, đậu, Brassica oleracea (ví dụ bắp cải) và các loài rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu, và cả thực vật lấy quả (với các loại quả táo, lê, các loại quả chi cam chanh và nho). Các cây trồng theo mùa vụ có thể là thực vật thu được bằng cách nhân giống thông thường và các phương pháp tối ưu hóa hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và thao tác di truyền hoặc kết hợp của các phương pháp này, bao gồm thực vật chuyển gen và gồm giống cây trồng có khả năng bảo vệ hoặc không có khả năng bảo vệ bởi quyền của người chọn tạo giống cây trồng. Thực vật sẽ được hiểu nghĩa là tất cả các giai đoạn phát triển của thực vật, ví dụ hạt, cành giâm và thực vật non (chưa trưởng thành) cho đến thực vật trưởng thành. Các bộ phận của thực vật được hiểu là tất cả các bộ phận và cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, hoa và rễ, ví dụ lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thể quả, quả và hạt, và cả rễ, thân củ và thân rễ. Các bộ phận của thực vật cũng bao gồm cả vật liệu được thu hoạch (thực vật hoặc các phần của thực vật được thu hoạch) và vật liệu gây giống sinh sản và sinh dưỡng, ví dụ cành giâm, thân củ, thân rễ, cành ghép và hạt.

Theo sáng chế, việc xử lý thực vật và các bộ phận của thực vật bằng hợp chất có công thức (I) được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách cho hợp chất tác động lên các vùng xung quanh, môi trường hoặc không gian bảo quản bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng phương pháp ngâm, phun, làm bay hơi, tạo sương, tung rắc, quét lên, tiêm và trong trường hợp vật liệu nhân giống, đặc biệt là trong trường hợp hạt giống, tương tự bằng cách ứng dụng một hoặc nhiều lớp phủ.

Như đã đề cập ở trên, cũng có thể xử lý tất cả các cây trồng và bộ phận của chúng theo sáng chế. Theo một phương án ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và giống thực vật, hoặc các loại thu được bằng phương pháp tạo giống sinh học thông thường, như lai giống hoặc dung hợp tế bào trần, và các bộ phận của chúng, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng kỹ thuật di truyền, nếu

thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng được xử lý. Thuật ngữ “bộ phận” hoặc “bộ phận của thực vật” hoặc “bộ phận thực vật” đã được giải thích trên đây. Theo sáng chế, tốt hơn là xử lý thực vật thuộc các giống thông thường trên thị trường tương ứng hoặc các loài đang sử dụng. Giống thực vật được hiểu theo nghĩa là các cây có đặc tính (“tính trạng”) mới được phát triển bằng phương pháp tạo giống truyền thống, gây đột biến hoặc các kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Giống thực vật có thể là cây giống, giống, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

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

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen được ưu tiên (các loài thu được bằng kỹ thuật di truyền) mà cần được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các thực vật mà, thông qua sự biến đổi di truyền, nhận được vật liệu di truyền mà sẽ truyền các đặc tính (“tính trạng”) hữu dụng đặc biệt có lợi cho các thực vật này. Ví dụ về các đặc tính này là sự sinh trưởng tốt hơn, khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp tăng, khả năng chịu hạn hoặc các mức nước hoặc độ mặn của đất tốt hơn, hiệu suất ra hoa tăng, thu hoạch dễ hơn, nhanh chín hơn, năng suất thu hoạch cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng cao hơn của các sản phẩm được thu hoạch, thời gian bảo quản và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn. Các ví dụ khác và đặc biệt được nhấn mạnh về các đặc tính như vậy là tăng tính kháng của thực vật chống lại các động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại côn trùng, nhện, giun tròn, ve bét, ốc sên và ốc, ví dụ nhờ các độc tố tạo ra trên thực vật, đặc biệt là các độc tố hình thành trên thực vật bằng vật liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, bởi các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả tổ hợp của các gen này), và cả tăng tính kháng của thực vật chống lại nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh thực vật, ví dụ gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (systemic acquired resistance - SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc tố được biểu hiện tương ứng, và cả tăng khả năng chống chịu của thực vật đối với một số hoạt chất diệt cỏ nhất định, ví dụ, các imidazolinon, sulfonyle, glyphosat hoặc phosphinothricin (ví dụ, gen "PAT"). Các gen truyền đặc tính (“tính trạng”) mong muốn cũng có thể có mặt kết hợp với nhau trong thực vật chuyển gen. Ví dụ về thực vật chuyển gen bao gồm các cây trồng quan trọng, như ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải dầu và cả thực vật lấy quả (với các loại quả táo, lê, các loại quả

cam quýt và nho), đặc biệt ưu tiên có thể kể đến ngô, đậu tương, lúa mì, lúa, khoai tây, bông, mía đường, thuốc lá và cải dầu. Các đặc tính (“tính trạng”) đặc biệt được tốt nhất là tăng tính kháng của thực vật chống lại côn trùng, nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý

Thực vật hoặc các bộ phận của thực vật được xử lý bằng các hợp chất có công thức (I) một cách trực tiếp hoặc bằng cách tác động lên vùng xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản nhờ sử dụng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách nhúng, phun, phun mù, tưới, làm bay hơi, phun bụi, tạo sương, tung rắc, tạo bọt, quét lên, phết lên, tiêm, tưới nước (tưới ướt), tưới ngập và trong trường hợp vật liệu nhân giống, đặc biệt là trong trường hợp hạt giống, ngoài ra, bằng cách xử lý hạt khô, bằng cách xử lý hạt ở dạng lỏng, bằng cách xử lý ở dạng huyền phù đặc, bằng cách phủ lên vỏ ngoài, bằng cách phủ bằng một hoặc nhiều lớp phủ, v.v.. Ngoài ra, có thể áp dụng hợp chất có công thức (I) bằng phương pháp thể tích cực nhỏ hoặc bơm dạng ứng dụng hoặc chính hợp chất có công thức (I) vào trong đất.

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

Trong trường hợp hoạt chất tác động theo đường hệ thống, hợp chất có công thức (I) cũng tiếp cận thực vật thông qua hệ rễ. Sau đó, thực vật được xử lý thông qua sự tác động của hợp chất có công thức (I) lên môi trường sống của thực vật. Việc xử lý này có thể được hoàn thành, ví dụ, bằng cách tưới ướt, hoặc bằng cách kết hợp vào trong đất hoặc dung dịch chất dinh dưỡng, có nghĩa là, vị trí của thực vật (ví dụ, các hệ trồng trong đất hoặc trong nước) được thấm bởi dạng dịch lỏng của hợp chất có công thức (I), hoặc bằng cách áp dụng lên đất, có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) được đưa ở dạng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong vị trí của thực vật. Trong trường hợp cây trồng là lúa, việc xử lý này cũng có thể được hoàn thành bằng cách định lượng hợp chất có công thức (I) ở dạng áp dụng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong cánh đồng lúa ngập nước.

Xử lý hạt

Việc kiểm soát các sinh vật gây hại bằng cách xử lý hạt của cây đã được biết đến trong một thời gian dài và là đối tượng của những cải tiến liên tục. Tuy nhiên, việc xử lý hạt dẫn đến hàng loạt vấn đề mà thường không thể giải quyết được một cách thỏa mãn.

Do đó, tốt hơn là phát triển các phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm mà phương pháp này không cần hoặc ít nhất giảm thiểu đáng kể việc sử dụng thêm chất diệt sinh vật gây hại trong quá trình bảo quản, sau khi gieo hạt hoặc sau khi thực vật nhú mầm. Ngoài ra, cần tối ưu hóa lượng hoạt chất được sử dụng để tạo ra sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm khỏi sự tấn công của các động vật gây hại, mà không gây tổn hại cho chính thực vật này bởi hoạt chất được sử dụng. Cụ thể, các phương pháp xử lý hạt cũng cần phải tính đến các đặc tính diệt côn trùng hoặc diệt giun tròn nội sinh của thực vật chuyển gen kháng hoặc chịu được sinh vật gây hại nhằm để đạt được sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm với lượng chất diệt sinh vật gây hại tối thiểu.

Do đó, sáng chế đặc biệt đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm, tránh được sự tấn công của các sinh vật gây hại, bằng cách xử lý hạt bằng một trong số các hợp chất có công thức (I). Ngoài ra, phương pháp theo sáng chế để bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm chống lại sự tấn công của các sinh vật gây hại còn bao gồm phương pháp, trong đó hạt được xử lý đồng thời trong một công đoạn hoặc tuần tự bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn. Sáng chế còn bao gồm phương pháp, trong đó hạt được xử lý tại các thời điểm khác nhau bằng hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn.

Tương tự, phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) trong xử lý hạt để bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm tránh khỏi sinh vật gây hại.

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

Sáng chế còn đề cập đến hạt, sau khi xử lý bằng hợp chất có công thức (I), được cho qua quy trình phủ màng để ngăn ngừa sự mài mòn của hạt.

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

Một ưu điểm nữa là việc xử lý hạt bằng hợp chất có công thức (I) có thể gia tăng sự nảy mầm và phát triển của hạt đã xử lý.

Cũng có thể coi là ưu điểm ở chỗ hợp chất có công thức (I) còn đặc biệt có thể được sử dụng cho hạt chuyển gen.

Hơn nữa, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng kết hợp với các chế phẩm trong lĩnh vực công nghệ truyền tín hiệu, dẫn đến sự tạo cụm tốt hơn bằng các hiện tượng cộng sinh, ví dụ như, chủng vi khuẩn nốt rễ, nấm cộng sinh mycorrhizae và/hoặc vi khuẩn hoặc nấm nội ký sinh thực vật và/hoặc dẫn đến sự cố định nitơ tối ưu.

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để bảo vệ hạt giống thực vật bất kỳ được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong trồng rừng hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn nữa, hạt nêu trên bao gồm hạt của ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, kê và yến mạch), ngô, bông, đậu tương, lúa, khoai tây, hướng dương, cà phê, thuốc lá, cây cải dầu, cải dầu, củ cải đường (ví dụ, củ cải đường và củ cải đường trong chăn nuôi), đậu phộng, các loại rau (ví dụ, cà chua, dưa chuột, đậu, các loại rau họ cải, hành và rau diếp), thực vật lấy quả, cỏ và cây cảnh. Đặc biệt đáng chú ý là việc xử lý hạt ngũ cốc (như lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen và yến mạch), ngô, đậu tương, bông, cây cải dầu, rau, nho lấy dầu và gạo,

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

lý hạt chuyển gen chứa ít nhất một gen khác loại có nguồn gốc từ *Bacillus* sp. Gen khác loại tốt hơn nữa là có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*.

Trong bối cảnh theo sáng chế, hợp chất có công thức (I) được áp dụng đưa lên hạt. Tốt hơn là, hạt được xử lý ở trạng thái trong đó hạt này ở mức ổn định đủ để không xuất hiện bất kỳ tổn hại nào trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ trong khoảng từ lúc thu hoạch đến khi gieo. Thường sử dụng hạt được tách ra khỏi cây và tách khỏi lõi, vỏ hạt, thân, vỏ, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt mà hạt này đã được thu hoạch, làm sạch và sấy khô tới hàm lượng ẩm cho phép để bảo quản. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà sau khi sấy khô đã được xử lý bằng, ví dụ, nước và sau đó lại được sấy khô, ví dụ môi nước. Trong trường hợp hạt lúa gạo, cũng có thể sử dụng hạt mà đã được ngâm nở trong nước đến giai đoạn nhất định (giai đoạn mầm nhú lên bằng cách phá vỡ lớp vỏ - pigeon breast stage) ví dụ, dẫn đến cải thiện khả năng nảy mầm và khả năng nhú mầm đồng đều hơn.

Khi xử lý hạt, cần phải cẩn thận, lượng hợp chất có công thức (I) được đưa lên hạt và/hoặc lượng các chất phụ gia khác được chọn theo cách sao cho sự nảy mầm của hạt không bị tác động bất lợi, hoặc sao cho thực vật sinh ra không bị tổn hại. Điều này cần phải được bảo đảm, đặc biệt trong trường hợp các hoạt chất có thể biểu hiện các tác dụng gây độc cho thực vật ở các tỷ lệ áp dụng nhất định.

Nói chung, hợp chất có công thức (I) được đưa lên hạt ở dạng chế phẩm thích hợp. Chế phẩm và quy trình xử lý hạt thích hợp là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực.

Hợp chất có công thức (I) có thể được chuyển hóa thành chế phẩm xử lý hạt thông thường, như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, huyền phù đặc hoặc các hỗn hợp phù ngoài khác dùng cho hạt và cả chế phẩm ULV.

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

Thuốc nhuộm mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt có thể sử dụng theo sáng chế là tất cả các thuốc nhuộm mà thông thường cho các mục đích này. Có thể sử dụng

các thuốc nhuộm ít tan trong nước hoặc chất màu tan trong nước. Ví dụ bao gồm cả chất màu đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Thuốc nhuộm Đỏ 112 và C.I. Đỏ dung môi 1.

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

Chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa thích hợp mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng trong phối chế của các hoạt chất hóa nông. Các chất phân tán không ion hoặc anion hoặc các hỗn hợp chứa các chất phân tán không ion hoặc anion có thể được ưu tiên sử dụng. Các chất phân tán không ion thích hợp bao gồm đặc biệt là các polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylfenol polyglycol ete và tristryrylphenol polyglycol ete và các dẫn xuất phosphat hóa hoặc sulfat hóa của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là lignosulfonat, muối của axit polyacrylic và chất ngưng tụ arylsulfonat-formaldehyt.

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

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

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

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

Giberelin mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế có thể tốt hơn là giberelin A1, A3 (= axit giberelic), A4 và A7; đặc biệt ưu tiên sử dụng axit giberelic. Các giberelin là đã biết (xem trong R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412).

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

Để xử lý hạt bằng chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế, hoặc các dạng sử dụng được điều chế từ đó, tất cả các đơn vị phối trộn có thể sử dụng được theo cách thông thường trong xử lý hạt đều hữu dụng. Cụ thể, quy trình trong xử lý hạt là đưa hạt vào trong thiết bị trộn vận hành theo từng mẻ hoặc vận hành liên tục, bổ sung lượng chế phẩm xử lý hạt mong muốn cụ thể, ở dạng như vậy hoặc sau khi pha loãng trước với nước và trộn cho tới khi chế phẩm này được phân bố đồng đều lên hạt. Nếu thích hợp, tiếp theo công đoạn này là công đoạn làm khô.

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

Sức khỏe của động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, tức là trong lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) có hoạt tính chống lại các ký sinh trùng trên động vật, đặc biệt là ngoại ký sinh trùng hoặc sinh vật nội ký sinh. Thuật ngữ "nội ký sinh trùng" bao gồm đặc biệt là giun sán và động vật nguyên sinh, như cầu trùng coccidia. Ngoại ký sinh trùng điển hình và tốt hơn là ngành chân khớp, đặc biệt là côn trùng và ve bét.

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

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

Vật nuôi trong gia đình bao gồm, ví dụ, động vật có vú, như chuột đồng, chuột bạch, chuột cống, chuột nhắt, sóc sinsin, chồn sương và đặc biệt là chó, mèo, chim cảnh, bò sát, động vật lưỡng cư và cá cảnh.

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

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

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

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

Ngành chân khớp (Arthropods) bao gồm:

thuộc bộ Anoplurida, ví dụ *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; thuộc bộ Mallophagida và phân bộ Amblycerina và Ischnocerina, ví dụ *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; thuộc bộ Diptera và phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; thuộc bộ Siphonapterida, ví dụ *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

thuộc bộ bọ xít (Heteropterida), ví dụ *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; và cả các sinh vật gây khó chịu và liên quan đến vệ sinh thuộc bộ Blattarida.

Động vật chân khớp còn bao gồm:

thuộc phân lớp ve bét (Acarina) và bộ ve (Metastigmata), ví dụ thuộc họ tíc (argasidae) như *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., thuộc họ Ixodidae như *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (giống ban đầu thuộc tíc đa vật chủ); thuộc bộ ve (Mesostigmata) như *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; thuộc bộ Actinedida (Prostigmata), ví dụ *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombiculla* spp., *Listrophorus* spp.; và thuộc bộ Acaridida (Astigmata), ví dụ *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Động vật nguyên sinh ký sinh bao gồm:

Trùng roi (Flagellata), ví dụ Trypanosomatidae, ví dụ, *Trypanosoma b. brucei*, *T. b. gambiense*, *T. b. rhodesiense*, *T. congolense*, *T. cruzi*, *T. evansi*, *T. equinum*, *T. lewisi*, *T. percae*, *T. simiae*, *T. vivax*, *Leishmania brasiliensis*, *L. donovani*, *L. tropica*, ví dụ Trichomonadidae, ví dụ, *Giardia lamblia*, *G. canis*;

Sarcomastigophora (Rhizopoda) như Entamoebidae, ví dụ *Entamoeba histolytica*, Hartmanellidae, ví dụ, *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;

Apicomplexa (Sporozoa) như Eimeridae, ví dụ, *Eimeria acervulina*, *E. adenoides*, *E. alabamensis*, *E. anatis*, *E. anserina*, *E. arloingi*, *E. ashata*, *E. auburnensis*, *E. bovis*, *E. brunetti*, *E. canis*, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandali*, *E. deblickei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoides*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. intestinalis*, *E. iroquoia*, *E. irresidua*, *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagritidis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E. stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystispora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, cụ thể là *C. parvum*; như Toxoplasmatidae, ví dụ *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; như Sarcocystidae, ví dụ *Sarcocystis bovicanis*, *S. bovis*, *S. ovicanis*, *S. ovifelis*, *S. neurona*, *S. spec.*, *S. suis*, *S. suis*, như Leucosporidae, ví dụ *Leucosporidium simondi*, như Plasmodiidae, ví dụ *Plasmodium berghei*, *P. falciparum*, *P. malariae*, *P. ovale*, *P. vivax*, *P. spec.*, như Piroplasmae, ví dụ *Babesia argentina*, *B. bovis*, *B. canis*, *B. spec.*, *Theileria parva*, *Theileria spec.*, như Adeleina, ví dụ *Hepatozoon canis*, *H. spec.*

Sinh vật nội ký sinh gây bệnh là giun sán, bao gồm giun dẹp (ví dụ, sán lá đơn chủ, sán dây và sán máng), giun tròn, giun đầu móc, và ngành năm lỗ miệng. Chúng gồm: sán lá đơn chủ (Monogenea): ví dụ: *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.;

sán dây: thuộc bộ Pseudophyllidea, ví dụ: *Diphyllbothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diphlogonoporus* spp.;

thuộc bộ xyclophyllida, ví dụ: *Mesocostoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina*

spp., *Stilesia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andyra* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Echinolepis* spp., *Echinocotyle* spp., *Diorchis* spp., *Dipylidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Diplopylidium* spp.;

sán mǎng: thuộc lớp Digenea, ví dụ: *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austroilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucochloridium* spp., *Brachylaima* spp., *Echinostoma* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *xyclocoelum* spp., *Typhlocoelum* spp., *Paramphistomum* spp., *Calicophoron* spp., *Cotylophoron* spp., *Gigantocotyle* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Notocotylus* spp., *Catatropis* spp., *Plagiorchis* spp., *Prosthogonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Eurytrema* spp., *Troglootrema* spp., *Paragonimus* spp., *Collyriclum* spp., *Nanophyetus* spp., *Opisthorchis* spp., *Clonorchis* spp., *Metorchis* spp., *Heterophyes* spp., *Metagonimus* spp.;

Giun tròn: Trichinellida, ví dụ: *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Paracapillaria* spp., *Eucoleus* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp.;

thuộc bộ Tylenchida, ví dụ: *Micronema* spp., *Strongyloides* spp.;

thuộc bộ Rhabditida, ví dụ: *Strongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *xyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neoststrongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumoststrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphoststrongylus* spp., *Parelaphoststrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp., *Teladorsagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nippostrongylus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Nematodirus* spp., *Hyoststrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp.;

thuộc bộ Spirurida, ví dụ: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp., *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspicularis* spp., *Heterakis* spp.; *Ascaris* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Baylisascaris* spp., *Parascaris* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp.; *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp.; *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp., *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., *Spirocerca* spp.;

giun đầu móc: thuộc bộ Oligacanthorhynchida, ví dụ: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; thuộc bộ Polymorphida ví dụ: *Filicollis* spp.; thuộc bộ Moniliformida, ví dụ: *Moniliformis* spp.;

thuộc bộ Echinorhynchida, ví dụ *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.;

Ngành năm lỗ miệng: Porocephalida, ví dụ, *Linguatula* spp.

Trong lĩnh vực thú y và trong lĩnh vực chăn nuôi động vật, hợp chất có công thức (I) được sử dụng bằng các phương pháp thường đã biết trong lĩnh vực này, như qua đường ruột, ngoài đường tiêu hóa, đường da hoặc mũi dưới dạng chế phẩm thích hợp. Việc sử dụng có thể là phòng ngừa hoặc điều trị.

Do đó, phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm thuốc.

Phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm tác nhân chống nội ký sinh trùng, đặc biệt là tác nhân chống giun sán hoặc tác nhân chống động vật nguyên sinh. Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng làm tác nhân chống nội ký sinh trùng, đặc biệt là tác nhân chống giun sán hoặc tác nhân chống động vật nguyên sinh, ví dụ trong nhân giống động vật, trong chăn nuôi động vật, trong các chuồng nuôi động vật và trong lĩnh vực vệ sinh.

Phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm tác nhân chống ngoại ký sinh trùng, đặc biệt là tác nhân diệt động vật ngành chân khớp như chất diệt côn trùng hoặc chất diệt ve bét. Phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm tác nhân chống ngoại ký sinh trùng, đặc biệt là tác nhân diệt động vật chân khớp như chất diệt côn trùng hoặc chất diệt ve bét, ví dụ trong chăn nuôi động vật, trong nhân giống động vật, trong chuồng nuôi động vật hoặc trong lĩnh vực vệ sinh.

Các thành phần kết hợp trừ giun sán

Các thành phần kết hợp trừ giun sán sau đây có thể được kể đến theo cách minh họa:

các hoạt chất trừ giun sán bao gồm các hoạt chất diệt sán lá song chủ và diệt sán dây:

thuộc nhóm **lacton vòng lớn**, ví dụ: abamectin, doramectin, emamectin, eprinomectin, ivermectin, milbemycin, moxidectin, nemadectin, selamectin;

thuộc nhóm **benzimidazol** và **tiền benzimidazol**, ví dụ: albendazol, albendazol-sulfoxit, cambendazol, xyclobendazol, febantel, fenbendazol, flubendazol, mebendazol, netobimin, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol, thiabendazol, thiophanat, triclabendazol;

thuộc nhóm xyclooctadepsipeptid, ví dụ: emodepsid, PF1022;

thuộc nhóm các dẫn xuất aminoaxetonitril, ví dụ: monepantel;

thuộc nhóm tetrahydropyrimidin, ví dụ: morantel, pyrantel, oxantel;

thuộc nhóm imidazothiazol, ví dụ: butamisol, levamisol, tetramisol;

thuộc nhóm salixylanilid, ví dụ: bromoxanid, brotianid, clioxanid, closantel, niclosamid, oxcyclozanid, rafoxanid, tribromsalan;

thuộc nhóm paraherquamid, ví dụ: derquantel, paraherquamid;

thuộc nhóm aminophenylamidin, ví dụ: amidantel, amidantel loại axyl hóa (dAMD), tribendimidin;

thuộc nhóm phosphat hữu cơ, ví dụ: coumaphos, crufomat, diclofos, haloxon, naphthalofos, trichlorfon;

thuộc nhóm phenol được thế, ví dụ: bithionol, disophenol, hexaclophene, niclofolan, meniclopholan, nitroxynil;

thuộc nhóm piperazinon, ví dụ: praziquantel, epsiprantel;

thuộc các nhóm khác, ví dụ: amoscanat, bephenium, bunamidin, clonazepam, clorsulon, diamfenetid, diclophen, diethylcarbamazin, emetin, hetolin, hycanthon, lucanthon, Miracil, mirasan, niclosamid, niridazol, nitroxynil, nitroscanat, oltipraz, omphalotin, oxamniquin, paromomycin, piperazin, resorantel.

Kiểm soát vật truyền (vector)

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

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

1) Muỗi

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

2) Chấy rận: nhiễm trùng da, sốt phát ban do chấy rận;

3) Bọ chét: bệnh dịch, sốt phát ban địa phương;

4) Ruồi: bệnh ngủ (trypanosomiasis); dịch tả, các bệnh do vi khuẩn khác;

5) Ve bét: bệnh ghẻ, sốt phát ban do chấy rận, bệnh sốt do rickettsia, bệnh tularaemia, bệnh viêm não Saint Louis, bệnh viêm não do tíc đốt (TBE), sốt xuất huyết Crimean–Congo, bệnh do xoắn khuẩn borrelia;

6) Các loại tíc: bệnh do xoắn khuẩn borrelia như *Borrelia duttoni*, viêm não do tíc đốt, sốt Q (*Coxiella burnetii*), bệnh babesia (*Babesia canis canis*).

Ví dụ về các vật truyền trong ngữ cảnh của sáng chế là côn trùng, như rệp, ruồi, rầy hoặc bọ trĩ, các vật truyền này có thể truyền virus trên thực vật sang thực vật. Các vật truyền khác có khả năng truyền virus trên thực vật đó là nhện đỏ, chấy rận, bọ cánh cứng và giun tròn.

Ví dụ khác về các vật truyền theo sáng chế bao gồm côn trùng và lớp nhện như muỗi, đặc biệt là giống *Aedes*, *Anopheles*, ví dụ *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*,

A. dirus (sốt rét) và Culex, chấy rận, bọ chét, ruồi, mạt và tíc, các vật truyền này có khả năng truyền mầm bệnh sang động vật và/hoặc người.

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

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng trong phòng ngừa bệnh và/hoặc tác nhân gây bệnh được truyền bởi các vật truyền. Do đó, phần mô tả còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) để kiểm soát vật truyền, ví dụ, trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong trồng rừng, trong các khu vườn và trong các cơ sở giải trí và cả trong bảo vệ vật liệu và các sản phẩm lưu kho.

Bảo vệ các vật liệu công nghiệp

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

Các vật liệu công nghiệp trong ngữ cảnh này được hiểu có nghĩa là vật liệu vô tri vô giác, như tốt hơn là chất dẻo, chất dính kết, hồ dính, giấy và các-tông, da, gỗ, sản phẩm gỗ đã xử lý và chế phẩm phủ. Việc sử dụng theo sáng chế để bảo vệ gỗ là đặc biệt được ưu tiên.

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

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

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

Kiểm soát động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh

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

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

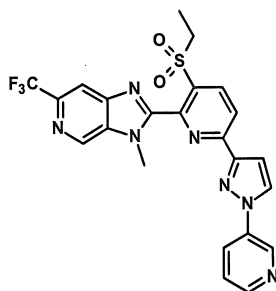
Ví dụ, việc ứng dụng được thực hiện ở dạng sản phẩm sol khí, sản phẩm phun không có áp, ví dụ, phun bằng bơm và phun bằng máy phun bụi, các hệ thống phun mù tự động, máy phun mù, ở dạng bột, gel, các sản phẩm bay hơi với viên nén bay hơi được làm từ xenluloza hoặc chất dẻo, dụng cụ làm bay hơi chất lỏng,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

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế

Ví dụ I-30

2-{3-(ethylsulfonyl)-6-[1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-yl]pyridin-2-yl}-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin

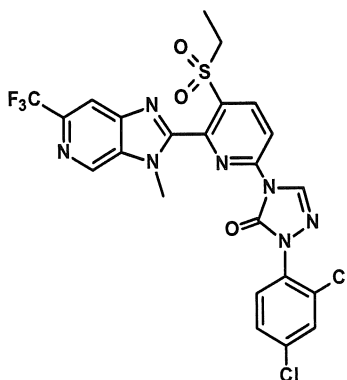


100 mg (0,24 mmol) 2-(6-(4-(2-(3-(trifluoromethyl)-1H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl)-1H-pyrazol-3-yl)-2-pyridyl)-5-ethylsulfonyl)-2-pyridyl)-1,2,4-triazol-3-one, 47 mg (0,24 mmol) axit [1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-yl]boric (để tổng hợp este axit boronic tương ứng, xem trong Tetrahedron Letters 2011, 52, 1506-1508) và 9 mg (0,01 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi(0) trước tiên được đưa vào trong hỗn hợp của dioxan đã khử khí (2 mL) và dung dịch natri cacbonat khử khí (1M, 1 mL) trong điều kiện khí quyển argon và được khuấy trong 14 giờ ở nhiệt độ 96°C. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng và cô đặc trong điều kiện áp suất giảm, và phần còn lại được xử lý trong nước và diclometan. Các pha được tách riêng, pha nước được chiết ba lần bằng diclometan và các pha hữu cơ kết hợp được làm khô bằng natri sulfat và được lọc. Dung môi được chưng cất trong điều kiện áp suất giảm và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột sử dụng gradien nước / axetonitril làm pha động.

logP (trung tính): 2,73; MH^+ : 514; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 3,97 (s, 3H), 7,31 (d, 1H), 7,62-7,65 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,39-8,41 (m, 1H), 8,58-8,65 (m, 3H), 8,81 (d, 1H), 9,26 (d, 1H), 9,33 (s, 1H).

Ví dụ I-2

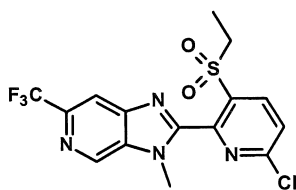
2-(2,4-Diclophenyl)-4-[5-ethylsulfonyl-6-[3-methyl-6-(trifluoromethyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-2-pyridyl]-1,2,4-triazol-3-on



50 mg (0,12 mmol) 2-(6-clo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin được hòa tan trong 5 ml axetonitril; 85,25 mg (0,37 mmol) 2-(2,4-diclophenyl)-4H-1,2,4-triazol-3-on, 20,49 mg (0,14 mmol) kali cacbonat và 32,19 mg (0,09 mmol) xesi cacbonat được bổ sung và hỗn hợp được khuấy trong 16 giờ ở nhiệt độ 65-70°C. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được lọc, nước cái được giải phóng ra khỏi dung môi trong điều kiện áp suất giảm và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột bằng phương pháp HPLC điều chế sử dụng gradien nước / axetonitril làm pha động.

logP (trung tính): 3,71; MH^+ : 598; 1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,84 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 7,65-7,73 (m, 2H), 7,94 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,70, (d, 1H), 8,78 (d, 1H), 9,09 (s, 1H), 9,35 (s, 1H).

2-(6-clo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin

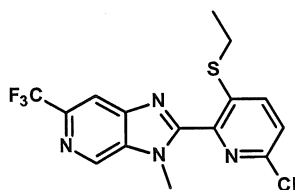


900 mg (2,41 mmol) 2-(6-clo-3-etylsulfanyl-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin được hòa tan trong 50 ml diclometan, 555,6 mg (12,0 mmol) axit formic và 1,64 mg (16,8 mmol) dung dịch hydro peroxit nồng độ 35% được bổ sung ở nhiệt độ trong phòng và sau đó, hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 5 giờ. Hỗn hợp được pha loãng bằng nước và dung dịch natri bisulfite được bổ sung, hỗn hợp được khuấy trong 1 giờ và dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa sau đó được bổ sung. Tách riêng pha hữu cơ, chiết pha nước hai lần bằng diclometan và tiếp theo pha

hữu cơ kết hợp được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột bằng phương pháp HPLC điều chế sử dụng gradien nước/axetonitril làm pha động.

logP (trung tính): 2,54; MH^+ : 405; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,20 (t, 3H), 3,77 (q, 2H), 3,91 (s, 3H), 8,13 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,30 (s, 1H).

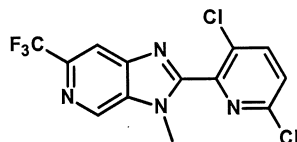
2-(6-clo-3-etylsulfanyl-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin



Hòa tan 4,00 g (10,7 mmol) 2-(3,6-diclo-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin trong 60 ml tetrahydrofuran, bổ sung 446 mg (11,1 mmol) natri hydrua ở $-5^\circ C$ và khuấy hỗn hợp ở $0^\circ C$ trong 30 phút. Sau đó, 733 mg (11,8 mmol) etanthiol được bổ sung từng giọt trong 30 phút ở nhiệt độ $-5^\circ C$, chậu làm lạnh được lấy ra và hỗn hợp được khuấy tiếp trong 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được thủy phân bằng nước, pha hữu cơ được tách riêng và pha nước được chiết hai lần bằng etyl axetat. Gộp pha hữu cơ lại, rửa bằng dung dịch natri clorua và làm khô bằng natri sulfat, sau đó chưng cất dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Tinh chế phần còn lại bằng cách nghiền với metyl tert-butyl keton / diclometan tỷ lệ 25:1.

logP (trung tính): 3,06; MH^+ : 373

2-(3,6-Diclo-2-pyridyl)-3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin



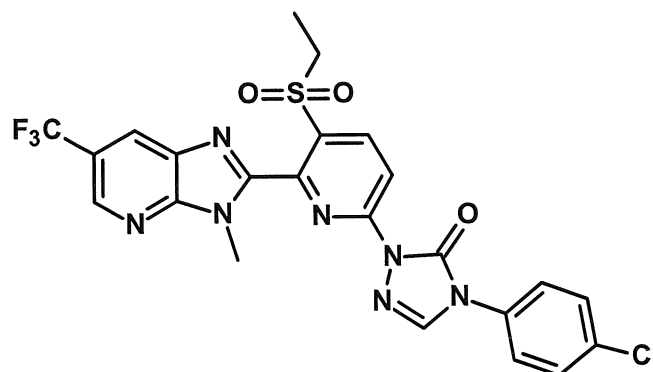
Khuấy 20 g (10,6 mmol) N^3 -metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin, 25,11 g (130,8 mmol) axit 3,6-diclopyridin-2-carboxylic và 20,06 g (104,6 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydroclorua (EDCI) trong 200 ml pyridin ở $120^\circ C$ trong 8 giờ. Hỗn hợp phản ứng được tách loại dung môi trong điều kiện áp suất giảm, bổ sung nước và chiết hỗn hợp ba lần bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được gộp lại và làm khô bằng natri sulfat, sau đó chưng cất dung môi trong điều kiện áp suất giảm. Tinh

chế phần còn lại bằng sắc ký cột sử dụng gradien xyclohexan / etyl axetat làm pha động.

logP (trung tính): 2,81; MH^+ : 347; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 3,99 (s, 3H), 7,89 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,35 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).

Ví dụ I-33

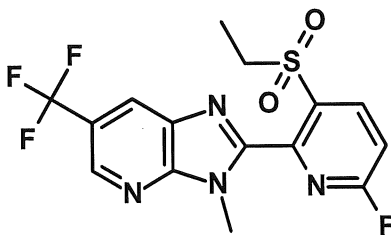
4-(4-clophenyl)-2-{5-(etylsulfonyl)-6-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]pyridin-2-yl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on



Trong điều kiện khí quyển argon, 2-[3-(etylsulfonyl)-6-flopyridin-2-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (50 mg, 0,12 mmol, 1 đương lượng) được hòa tan trong 8 ml axetonitril. Xesi cacbonat (62 mg, 0,19 mmol, 1,5 đương lượng), kali iodua (11 mg, 0,06 mmol, 0,5 đương lượng) và 4-(4-clophenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (50 mg, 0,25 mmol, 2 đương lượng) được bổ sung và hỗn hợp được gia nhiệt ở nhiệt độ 65-70°C trong 4 giờ. Sau khi làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, toàn bộ chất rắn được lấy ra bằng cách lọc và silicagel được bổ sung vào dung dịch phản ứng. Dung môi hữu cơ được loại bỏ trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký (pha động: xyclohexan, etyl axetat).

logP (trung tính): 3,52; MH^+ : 564; 1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 8,92 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,72 – 8,70 (m, 1H), 8,50 – 8,48 (m, 1H), 7,80 – 7,77 (m, 2H), 7,67 – 7,65 (m, 2H), 3,90 – 3,85 (m, 5H), 1,27 – 1,23 (m, 3H).

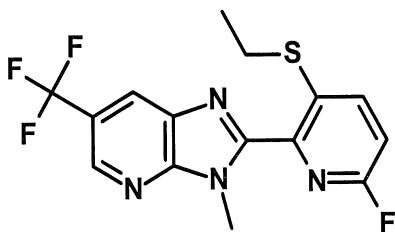
2-[3-(etylsulfonyl)-6-flopyridin-2-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin



2-[3-(ethylsulfonyl)-6-fluoropyridin-2-yl]-3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (5,0 g, 14 mmol) được hòa tan ở nhiệt độ trong phòng trong 144 ml diclometan. Axit formic (3,2 g, 70 mmol) và dung dịch nước hydro peroxit (35%, 9,5 g, 98 mmol) được bổ sung. Sau khi khuấy trong 12 giờ ở nhiệt độ trong phòng, 20 ml nước và sau đó, 20 ml dung dịch natri bisulfite 40% được bổ sung từ từ để kết thúc phản ứng. Hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ, sau đó các pha được tách riêng. Pha nước được chiết ba lần bằng diclometan, sau đó các phần chiết hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch NaHCO_3 bão hòa. Pha hữu cơ được làm khô bằng MgSO_4 , lọc và loại bỏ dung môi trong điều kiện áp suất giảm.

logP (trung tính): 2,80; MH^+ : 389; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) $\square$ ppm: 8,91 (m, 1H), 8,70 (m, 2H), 7,81 (dd, 1H), 3,82 (m, 5H), 1,22 (t, 3H)

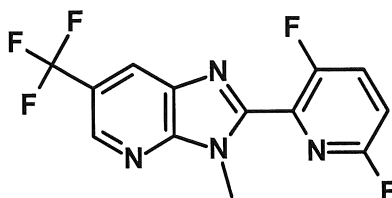
2-[3-(ethylsulfonyl)-6-fluoropyridin-2-yl]-3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin



2-(3,6-Difluoropyridin-2-yl)-3-methyl-6-(trifluoromethyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (2,5 g, 8,17 mmol) được hòa tan trong 19 ml THF khô và được làm lạnh xuống -10°C . NaH (60%, 340 mg, 8,5 mmol) được bổ sung và hỗn hợp được làm ấm lên nhiệt độ trong phòng cùng với khuấy. Một cách rất từ từ, ethyl mercaptan (559 mg, 9,0 mmol) hòa tan trong 10 ml THF khô được bổ sung từng giọt và hỗn hợp được khuấy trong 3 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng ethyl axetat và rửa hai lần bằng dung dịch NaCl bão hòa. Sau khi làm khô pha hữu cơ, cô đặc hỗn hợp trong điều kiện áp suất giảm và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột (pha động: gradien xyclohexan/ethyl axetat).

logP (trung tính): 3,45; MH^+ : 357; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 8,87 (s, 1H), 8,68 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 7,49 (dd, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,01 (q, 2H), 1,19 (t, 3H).

2-(3,6-Diflopyridin-2-yl)-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin

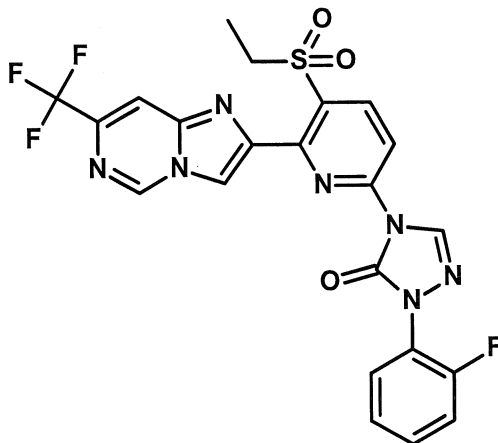


Trong điều kiện khí argon, N2-metyl-5-(triflometyl)pyridin-2,3-diamin (5,0 g, 18,3 mmol) được hòa tan trong 100 ml pyridin khô và axit 3,6-diflopyridin-2-carboxylic (2,9 g, 18,3 mmol) và N-(3-dimetylaminopropyl)-N'-etylcacodiimit hydroclorua (3,5 g, 18,3 mmol) được bổ sung vào đó. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 120°C trong thời gian 9 giờ. Sau khi làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, hỗn hợp được cô đặc trong điều kiện áp suất giảm và sau đó, pha loãng bằng etyl axetat. Pha hữu cơ được rửa bằng nước, làm khô bằng $MgSO_4$ và cô đặc trong điều kiện áp suất giảm. Sản phẩm có thể được tinh chế một phần bằng phương pháp tái kết tinh từ metyl tert-butyl etc.

(logP (trung tính): 2,72; MH^+ : 315; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 8,88 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 7,60 (m, 1H), 4,07 (s, 3H).

Ví dụ I-35

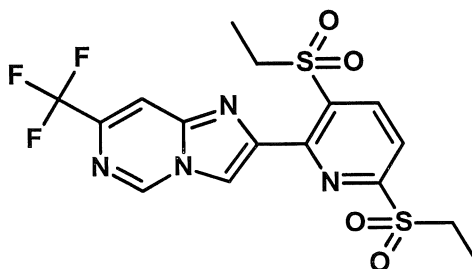
4-{5-(etylsulfonyl)-6-[7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-2-yl]pyridin-2-yl}-2-(2-flophenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on



2-[3,6-Bis(ethylsulfonyl)pyridin-2-yl]-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin (46 mg, 0,1 mmol, 1 đương lượng) được hòa tan trong điều kiện khí quyển argon trong 3 ml axetonitril, và xesi cacbonat (50 mg, 0,15 mmol, 1,5 đương lượng), kali iodua (8 mg, 0,05 mmol, 0,5 đương lượng) và 2-(2-flophenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (37 mg, 0,2 mmol, 2 đương lượng) được bổ sung vào đó. Hỗn hợp được khuấy trong thời gian 12 giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó, được gia nhiệt ở nhiệt độ hồi lưu trong thời gian 1 giờ. Sau khi làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, tất cả các thành phần rắn được loại ra bằng cách lọc và dung dịch được cô đặc trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký (pha động: xyclohexan, etyl axetat).

logP (trung tính): 3,16; MH^+ :534 ; 1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) $\square$ ppm: 9,65 (s, 1H), 9,17 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,72-8,67 (m, 1H), 8,48 – 8,46 (m, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,70 – 7,65 (m, 1H), 7,60 – 7,54 (m, 1H), 7,52 – 7,45 (m, 1H), 7,42 – 7,39 (m, 1H), 4,22 – 4,17 (m, 2H), 1,30 – 1,27 (m, 3H).

2-[3,6-Bis(ethylsulfonyl)pyridin-2-yl]-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin



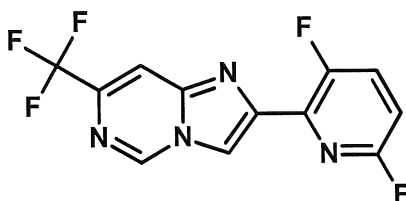
2-[3,6-Bis(ethylsulfonyl)pyridin-2-yl]-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin (100 mg, 0,33 mmol, 1 đương lượng) được hòa tan trong điều kiện khí quyển argon trong 2 ml DMF khô. Natri etanthiolat (168 mg, 1,99 mmol, 6 đương lượng) được bổ sung và hỗn hợp được khuấy trong thời gian 12 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp được pha loãng bằng etyl axetat và được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa. Pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat và dung môi được loại bỏ trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay. Sản phẩm thô được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

2-[3,6-Bis(ethylsulfonyl)pyridin-2-yl]-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin (75 mg, 0,19 mmol, 1 đương lượng) được hòa tan trong 9 ml diclometan. Ở nhiệt độ trong phòng, axit formic (90 mg, 1,95 mmol, 10 đương lượng) và dung dịch hydro peroxit (35%, 265 mg, 12,7 mmol, 14 đương lượng) được bổ sung và hỗn hợp được khuấy trong

thời gian 12 giờ. Sau khi bổ sung 1 ml wasser, 3 ml dung dịch natri bisulfit 40% được bổ sung từ từ từng giọt và hỗn hợp được khuấy trong thời gian 1 giờ. Sau đó, pha hữu cơ được tách riêng, rửa bằng dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa, sấy khô bằng natri sulfat và cô đặc. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký (pha động: xyclohexan, etyl axetat).

logP (trung tính): 2,28; MH^+ : 449; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 9,67 (s, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,82 – 8,80 (m, 1H), 8,41 (s, 1H), 8,36 – 8,34 (m, 1H), 4,23 – 4,18 (m, 2H), 3,64 – 3,59 (m, 2H), 1,30 – 1,23 (m, 6H).

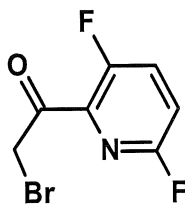
2-(3,6-Diflopyridin-2-yl)-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin



Trong một bình phản ứng thứ hai, 6-(triflometyl)pyrimidin-4-amin (201 mg, 1,23 mmol, 1 đương lượng) và natri hydrocacbonat (155 mg, 1,85 mmol, 1,5 đương lượng) được hòa tan hoặc được tạo huyền phù trong 3 ml cloroform. 2-Bromo-1-(3,6-diflopyridin-2-yl)etanon (502 mg, 1.23 mmol, 1 đương lượng) được bổ sung từng giọt hòa tan trong 1 ml cloroform, sau đó hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt ở nhiệt độ 60°C trong thời gian 4 giờ. Natri hydrocacbonat được lọc ra và pha hữu cơ được cô đặc. Phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp sắc ký (silica gel, pha động: xyclohexan/etyl axetat).

logP (trung tính): 2,02; ; MH^+ : 301; 1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) $\square$ ppm: 9,64 (s, 1H), 8,77 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,17 – 8,10 (m, 1H), 7,36 – 7,32 (m, 1H).

2-Bromo-1-(3,6-diflopyridin-2-yl)etanon

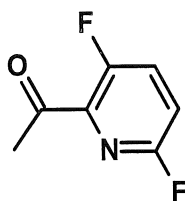


1-(3,6-Diflopyridin-2-yl)etanon (6,4 g, 40,7 mmol) được hòa tan trong 96 ml

etanol và đồng(II) bromua (13,7 g, 61,1 mmol) được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt ở nhiệt độ 60°C trong thời gian 4 giờ. Sau khi làm nguội xuống nhiệt độ trong phòng, dung môi được loại bỏ trên thiết bị làm bay hơi kiểu quay và phần còn lại được xử lý bằng dung dịch amoni clorua bão hòa và bằng etyl axetat. Pha nước được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các phần chiết hữu cơ kết hợp được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, sấy khô bằng natri sulfat và cô đặc. Sản phẩm được tách ở dạng hỗn hợp và được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 1,95; MH^+ : 2,38; 1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8,17 – 8,10 (m, 1H), 7,62 – 7,57 (m, 1H), 2,56 (s, 2H)

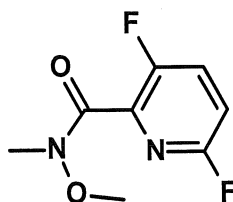
1-(3,6-Diflopyridin-2-yl)etanon



Trong điều kiện khí quyển argon, 3,6-diflo-N-metoxi-N-metylpyridin-2-carboxamide (10,1 g, 50,2 mmol) được hòa tan trong 270 ml THF khô và được làm lạnh xuống 0°C. Metyl magie bromua (3M trong dietyl ete, 50 ml, 150 mmol) được bổ sung từ từ từng giọt, sau đó hỗn hợp được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 0°C. Để kết thúc phản ứng, 50 ml dung dịch amoni clorua được bổ sung từ từ cùng với làm lạnh. Pha hữu cơ được tách riêng, được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa và được cô đặc. Sản phẩm được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 1,24; MH^+ : 158; 1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8,16 – 8,10 (m, 1H), 7,61 – 7,57 (m, 1H), 2,56 – 2,55 (m, 3H).

3,6-Diflo-N-metoxi-N-metylpyridin-2-carboxamit



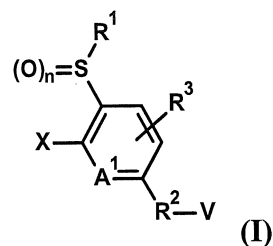
Axit 3,6-diflopyridin-2-carboxylic (15 g, 94 mmol) và N,O-dimetylhydroxylamin

hydroclorua (9,1 g, 94,2 mmol) được hòa tan trong 600 ml diclometan và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C. 4-Dimethylaminopyridin (DMAP, 13,8 g, 113 mmol) và N-(dimethylaminopropyl)-N'-etylcarbodiimide hydroclorua (EDCI, 19,9 g, 103 mmol) được bổ sung và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ 0°C, sau đó trong thời gian 12 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Dung dịch được rửa một lần bằng dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa và một lần bằng dung dịch natri clorua, sấy khô bằng natri sulfat và cô đặc. Sản phẩm thô được sử dụng trong phản ứng tiếp theo không cần tinh chế thêm.

logP (trung tính): 1,05; MH^+ : 203; 1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8,15 – 8,09 (m, 1H), 7,44 – 7,42 (m, 1H), 3,57 (s, 3H), 3,31 (s, 3H).

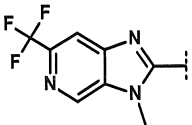
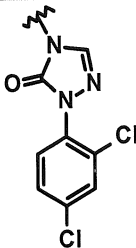
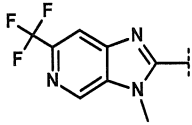
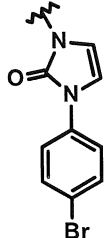
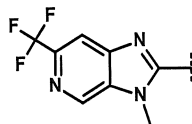
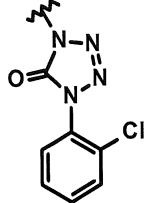
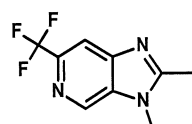
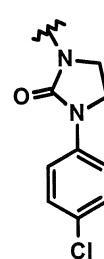
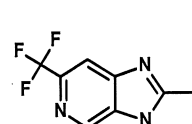
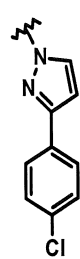
Theo cách tương tự như các ví dụ và theo các quy trình điều chế mô tả ở trên,

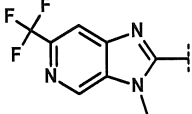
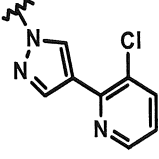
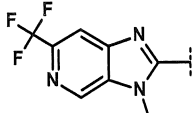
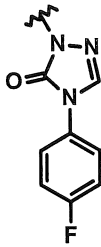
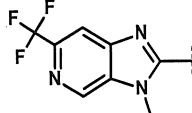
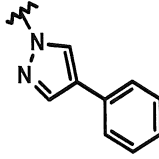
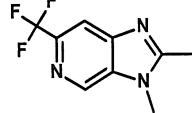
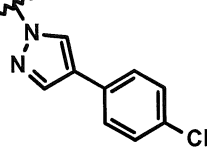
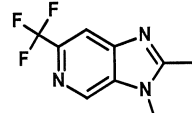
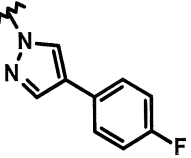
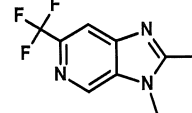
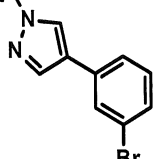
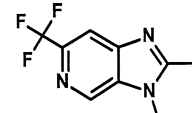
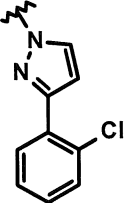
Các hợp chất có công thức (I) sau có thể thu được:

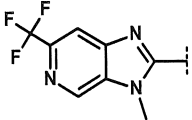
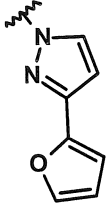
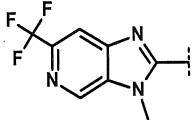
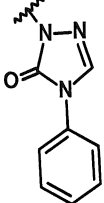
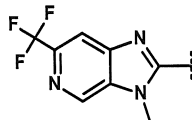
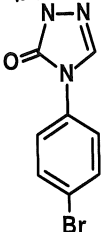
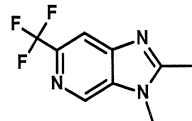
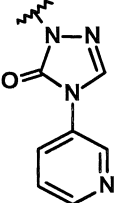
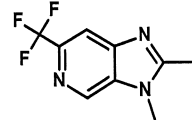
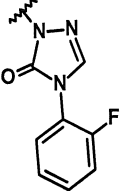
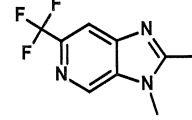
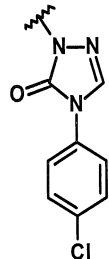


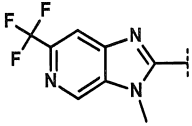
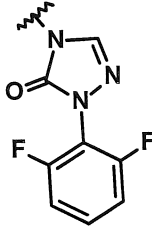
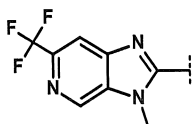
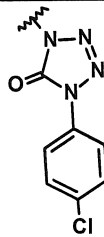
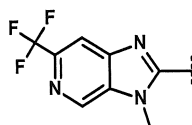
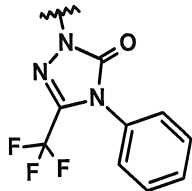
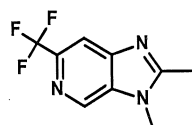
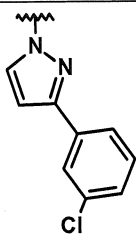
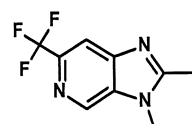
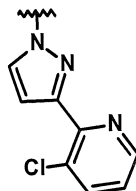
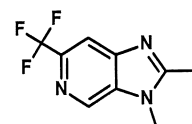
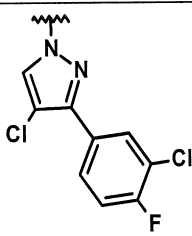
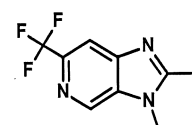
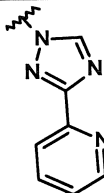
trong đó, các phân tử thế R^1 , R^2 , R^3 , A^1 , X , V và n có ý nghĩa như được nêu trong bảng dưới đây và trong đó, liên kết từ R^2 - V với phần còn lại của phân tử được mô tả đặc trưng bằng đường lượn sóng và liên kết từ X với phần còn lại của phân tử được mô tả đặc trưng bằng đường chấm chấm:

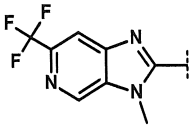
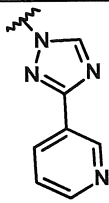
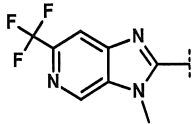
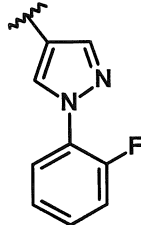
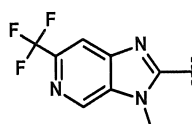
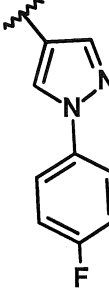
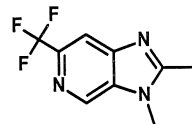
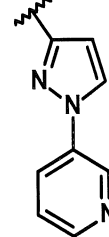
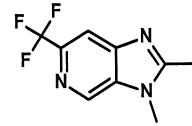
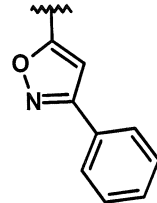
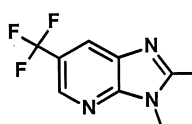
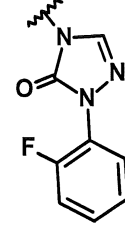
Ví dụ	R^1	n	A^1	R^3	X	R^2 - V
I-1	$-CH_2CH_3$	2	N	-H		

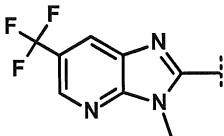
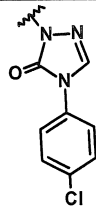
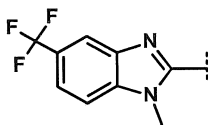
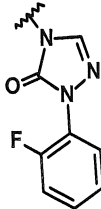
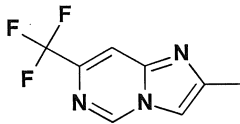
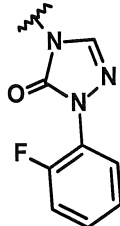
I-2	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-3	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-4	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-5	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-6	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		

I-7	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-8	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-9	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-10	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-11	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-12	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-13	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		

I-14	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-15	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-16	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-17	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-18	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-19	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-20	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-21	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-22	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-23	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-24	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-25	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-26	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-27	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-28	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-29	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-30	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-31	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-32	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-33	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-34	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-35	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

Ví dụ I-1: logP (trung tính): 3,03 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,352(4,6);9,070(6,9);8,791(2,3);8,768(4,5);8,724(4,5);8,702(2,4);8,339(4,9);7,677(0,9);7,662(1,6);7,658(1,8);7,642(0,9);7,638(1,0);7,598(0,3);7,581(0,9);7,564(1,1);7,550(0,7);7,546(0,6);7,519(1,3);7,496(1,5);7,474(0,7);7,426(1,2);7,405(1,9);7,388(0,8);4,005(16,0);3,873(1,0);3,855(3,5);3,836(3,5);3,818(1,1);3,315(67,6);2,670(1,0);2,505(123,3);2,501(159,0);2,497(120,2);2,328(1,0);2,324(0,7);2,073(0,6);1,253(3,8);1,235(8,4);1,216(3,7);0,000(11,1)

Ví dụ I-3: logP (trung tính): 3,87 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,326(4,7);9,288(0,5);8,854(3,0);8,832(4,1);8,686(3,8);8,663(3,0);8,324(5,0);8,314(1,1);8,304(0,4);8,291(0,6);8,243(0,4);7,767(2,1);7,744(7,6);7,727(7,5);7,705(2,2);7,664(0,4);7,639(3,7);7,630(4,0);7,616(0,4);7,587(0,4);7,565(0,5);7,548(0,5);7,510(0,6);7,491(0,4);7,446(3,7);7,437(3,6);7,417(0,5);7,368(0,4);7,361(0,3);7,126(0,3);3,980(0,8);3,968(16,0);3,954(0,8);3,902(1,3);3,875(0,5);3,868(0,5);3,823(1,6);3,802(3,6);3,784(3,8);3,766(1,4);3,702(0,3);3,685(0,4);3,385(0,4);3,361(0,7);3,319(476,1);2,671(2,9);2,666(2,1);2,506(375,7);2,501(483,5);2,497(351,0);2,332(2,2);2,328(2,9);1,268(0,4);1,242(4,1);

1,223(8,7);1,205(4,3);1,184(1,5);1,166(1,0);1,150(0,6);1,132(0,6);1,115(0,4);1,105(0,4);0,000(25,3);-0,008(1,0)

Ví dụ I-4: logP (trung tính): 3,34 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,323(4,0);8,866(3,3);8,844(3,9);8,580(3,9);8,558(3,6);8,348(4,3);7,843(3,0);7,839(1,8);7,824(3,9);7,820(2,4);7,737(0,8);7,732(0,9);7,718(1,7);7,713(1,6);7,698(1,2);7,693(1,1);7,678(1,4);7,674(1,4);7,659(1,7);7,655(1,6);7,639(0,6);7,636(0,6);3,998(16,0);3,888(0,9);3,870(3,3);3,851(3,3);3,833(1,0);3,319(75,1);2,676(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,524(1,3);2,511(33,7);2,507(71,0);2,502(95,3);2,498(69,4);2,493(34,6);2,333(0,4);2,329(0,6);2,324(0,4);1,263(3,6);1,244(8,1);1,226(3,5);0,008(0,5);0,000(15,8);-0,008(0,7)

Ví dụ I-5: logP (trung tính): 3,86 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,305(4,0);8,681(3,3);8,658(4,4);8,470(3,9);8,447(3,4);8,313(0,5);8,299(4,2);7,735(0,4);7,727(4,0);7,722(1,4);7,710(1,4);7,705(5,0);7,697(0,5);7,502(0,5);7,494(5,2);7,489(1,5);7,477(1,3);7,471(4,4);7,463(0,4);4,162(0,9);4,144(1,9);4,137(1,3);4,122(1,8);4,026(1,7);4,005(1,8);3,985(0,9);3,942(16,0);3,764(1,0);3,745(3,2);3,727(3,3);3,708(0,9);3,317(129,2);2,675(0,7);2,670(1,0);2,666(0,8);2,661(0,4);2,524(2,4);2,519(3,7);2,510(60,0);2,506(128,2);2,501(174,0);2,497(125,1);2,492(59,4);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,323(0,7);2,319(0,3);2,073(3,5);1,234(0,8);1,223(3,6);1,205(8,1);1,186(3,5);0,146(0,4);0,008(2,7);0,000(88,7);-0,008(3,0);-0,150(0,4)

Ví dụ I-6: logP (trung tính): 4,62 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,344(4,0);8,809(3,9);8,802(4,0);8,705(3,2);8,683(4,0);8,470(3,9);8,448(3,4);8,336(4,2);8,334(4,3);8,313(0,4);8,074(0,6);8,068(4,4);8,063(1,6);8,051(1,6);8,046(5,1);8,040(0,7);7,604(0,7);7,598(5,0);7,593(1,7);7,581(1,5);7,576(4,8);7,259(3,7);7,252(3,7);4,092(0,4);4,003(16,0);3,852(0,9);3,833(3,3);3,815(3,3);3,796(1,0);3,320(150,6);2,675(0,6);2,671(0,9);2,666(0,7);2,524(2,4);2,511(55,3);2,506(116,2);2,502(156,5);2,497(113,1);2,493(54,5);2,333(0,7);2,329(0,9);2,324(0,7);2,074(0,9);1,258(3,5);1,240(8,1);1,221(3,4);0,008(0,9);0,000(25,1);-0,008(1,0)

Ví dụ I-7: logP (trung tính): 3,66 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,389(0,4);9,326(3,9);9,247(5,1);9,246(5,4);9,205(0,4);8,727(3,4);8,705(4,1);8,640(5,3);8,638(5,5);8,611(2,1);8,607(2,3);8,599(2,3);8,596(2,3);8,565(0,4);8,465(3,9);8,457(0,4);8,453(0,4);8,443(3,6);8,346(0,4);8,338(4,1);8,337(4,2);8,048(2,1);8,045(2,2);8,028(

2,3);8,024(2,2);7,404(2,2);7,393(2,1);7,384(1,9);7,373(2,0);4,450(1,2);4,093(1,2);4,005(16,0);3,854(0,9);3,835(3,1);3,817(3,2);3,798(0,9);3,321(74,6);2,676(0,5);2,672(0,6);2,667(0,5);2,525(1,5);2,512(38,4);2,507(80,9);2,503(108,5);2,498(78,1);2,494(37,4);2,334(0,4);2,329(0,6);2,325(0,5);1,323(0,6);1,260(3,5);1,242(8,1);1,223(3,5);0,008(0,5);0,000(16,4);-0,009(0,6)

Ví dụ I-8: logP (trung tính): 2,75 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,311(4,0);8,815(9,1);8,710(3,2);8,688(4,2);8,522(4,2);8,500(3,6);8,327(4,2);8,326(4,2);8,313(0,6);8,147(1,2);7,789(2,2);7,783(0,9);7,776(2,4);7,771(1,4);7,766(2,7);7,759(0,9);7,754(2,6);7,462(2,7);7,456(0,8);7,440(4,3);7,423(0,7);7,418(2,4);4,316(0,4);3,977(16,0);3,849(0,9);3,831(3,3);3,812(3,3);3,794(1,0);3,780(0,5);3,317(81,6);2,679(0,5);2,675(1,0);2,670(1,5);2,666(1,1);2,524(3,3);2,519(5,1);2,510(85,2);2,506(183,7);2,501(249,8);2,497(180,2);2,492(85,3);2,332(1,0);2,328(1,5);2,323(1,1);2,073(0,8);1,988(0,4);1,447(0,4);1,430(0,4);1,250(3,6);1,231(8,1);1,213(3,5);1,175(0,4);0,146(1,4);0,008(10,3);0,000(329,0);-0,009(11,3);-0,150(1,4)

Ví dụ I-9: logP (trung tính): 3,92 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,364(4,1);9,170(5,0);8,683(3,4);8,661(4,1);8,535(5,1);8,409(3,9);8,387(3,6);8,344(4,3);8,312(0,7);7,823(3,2);7,805(3,4);7,420(1,9);7,401(3,8);7,382(2,4);7,302(1,3);7,284(1,9);7,266(0,8);4,454(0,4);4,029(16,0);3,853(0,9);3,834(3,2);3,815(3,3);3,797(1,0);3,324(225,0);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,3);2,524(4,2);2,511(103,9);2,506(219,7);2,502(297,2);2,497(215,9);2,493(105,4);2,333(1,2);2,329(1,7);2,324(1,3);1,261(3,6);1,242(8,4);1,224(3,6);0,146(1,3);0,008(10,2);0,000(295,2);-0,008(11,8);-0,150(1,3)

Ví dụ I-10: logP (trung tính): 4,33 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,407(0,7);9,368(4,3);9,341(0,4);9,228(5,1);9,218(1,0);9,140(0,5);8,697(0,6);8,686(3,2);8,675(0,8);8,664(3,9);8,554(5,2);8,508(0,9);8,458(0,5);8,419(0,9);8,407(3,8);8,397(0,6);8,385(3,4);8,365(0,8);8,344(4,6);8,314(3,6);8,218(0,3);7,911(0,7);7,889(0,8);7,874(4,4);7,857(1,9);7,853(5,0);7,837(0,6);7,642(0,4);7,621(0,4);7,513(0,8);7,492(0,7);7,469(5,1);7,464(2,0);7,448(4,7);7,441(1,0);7,403(0,4);7,383(0,3);4,447(2,6);4,113(1,6);4,056(0,4);4,038(1,4);4,027(16,0);4,002(0,6);3,854(1,0);3,835(3,2);3,817(3,3);3,798(1,0);3,317(190,9);3,293(1,8);2,675(1,6);2,670(2,2);2,666(1,6);2,524(5,5);2,510(134,9);2,506(276,1);2,501(366,7);2,497(267,2);2,333(1,5);2,328(2,1);2,324(1,6);2,073(1,5);1,988(

4,5);1,337(0,7);1,319(1,3);1,301(0,6);1,259(3,7);1,241(8,3);1,222(3,6);1,193(1,2);1,175(2,4);1,157(1,2);0,146(1,9);0,008(16,5);0,000(418,8);-0,009(19,1);-0,150(1,9)

Ví dụ I-11: logP (trung tính): 4,17 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,394(0,4);9,343(3,8);8,872(0,3);8,865(0,4);8,795(3,9);8,788(4,1);8,713(0,4);8,700(3,3);8,691(0,5);8,678(4,1);8,472(0,4);8,463(4,0);8,450(0,4);8,441(3,5);8,359(0,4);8,336(3,9);8,334(4,1);8,313(0,7);8,097(2,1);8,092(0,9);8,083(2,4);8,075(2,4);8,067(1,1);8,061(2,0);7,379(2,2);7,357(4,4);7,340(0,7);7,335(2,3);7,238(0,4);7,228(3,6);7,221(3,7);4,430(1,4);4,092(0,6);4,003(16,0);3,848(0,9);3,829(3,2);3,811(3,2);3,792(0,9);3,319(149,9);2,680(0,6);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,2);2,662(0,6);2,524(4,3);2,519(6,6);2,511(95,8);2,506(205,5);2,501(279,9);2,497(200,6);2,492(94,3);2,333(1,1);2,328(1,6);2,324(1,1);2,319(0,5);2,073(1,0);1,340(0,4);1,321(0,8);1,303(0,4);1,257(3,5);1,239(8,0);1,220(3,4);0,146(0,7);0,008(6,0);0,000(183,7);-0,009(6,3);-0,150(0,7)

Ví dụ I-12: logP (trung tính): 4,48 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,372(3,8);9,294(4,6);8,690(3,6);8,668(4,3);8,599(4,7);8,412(4,1);8,390(3,8);8,346(4,0);8,314(0,5);8,103(1,7);8,098(3,0);8,094(1,8);7,855(1,4);7,835(1,5);7,480(0,9);7,478(1,1);7,476(1,0);7,473(1,0);7,458(1,5);7,455(1,6);7,453(1,4);7,376(1,9);7,356(2,9);7,336(1,3);4,451(0,3);4,031(16,0);3,857(0,9);3,839(3,0);3,820(3,1);3,802(0,9);3,316(100,2);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,0);2,661(0,5);2,524(3,8);2,519(6,0);2,510(86,0);2,506(182,3);2,501(245,4);2,497(174,9);2,492(82,5);2,337(0,5);2,333(1,1);2,328(1,4);2,323(1,1);2,073(0,4);1,260(3,5);1,242(8,3);1,223(3,5);0,146(1,2);0,008(10,9);0,000(304,0);-0,009(10,9);-0,150(1,2)

Ví dụ I-13: logP (trung tính): 4,58 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,345(4,2);9,323(0,3);8,831(3,8);8,824(4,0);8,708(3,2);8,686(3,9);8,454(4,0);8,432(3,6);8,364(0,3);8,338(4,4);8,312(1,4);7,929(1,5);7,918(1,7);7,911(1,1);7,905(1,7);7,643(1,4);7,637(1,0);7,631(1,6);7,627(1,2);7,620(1,9);7,611(0,5);7,529(0,6);7,514(2,9);7,503(3,1);7,497(1,9);7,491(2,3);7,479(0,6);7,125(3,8);7,118(4,0);4,438(0,6);4,099(1,0);4,009(16,0);3,853(1,0);3,834(3,4);3,816(3,5);3,797(1,2);3,473(0,4);3,436(0,7);3,410(1,1);3,369(4,2);3,330(517,0);3,239(0,6);3,204(0,4);3,167(0,4);3,146(0,3);2,675(2,2);2,671(3,0);2,666(2,2);2,579(0,5);2,555(0,8);2,524(8,3);2,510(185,4);2,506(374,0);2,501(494,0);2,497(366,3);2,493(184,0);2,438(0,4);2,432(0,4);2,333(2,2);2,328(3,2);2,324(2,3);1,32

0(0,4);1,258(3,6);1,239(8,3);1,220(3,6);0,146(0,4);0,008(3,6);0,000(109,6);-
0,008(4,4);-0,150(0,4)

Ví dụ I-14: logP (trung tính): 3,47 ¹H-NMR(601,6 MHz, d₆-DMSO): δ=
9,340(4,7);8,781(3,5);8,776(3,5);8,686(3,0);8,672(3,3);8,387(3,4);8,372(3,1);8,329(4,9
);8,311(0,4);7,854(3,7);7,067(2,9);7,062(3,0);7,007(3,4);7,003(3,4);6,684(2,2);6,681(2,
7);6,678(2,6);6,676(2,2);3,999(16,0);3,835(1,3);3,823(3,6);3,810(3,8);3,798(1,3);3,310
(91,2);2,613(1,3);2,501(218,0);2,498(182,8);2,385(1,4);2,072(2,2);1,248(3,8);1,236(8,3
);1,224(4,3);0,000(4,6)

Ví dụ I-15: logP (trung tính): 2,70 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=
9,313(4,0);8,851(7,9);8,710(3,2);8,688(4,1);8,534(4,0);8,512(3,4);8,330(4,2);7,746(2,2
);7,743(3,0);7,724(3,5);7,601(2,0);7,582(3,5);7,562(2,3);7,478(1,4);7,459(2,0);7,441(0,
7);3,979(16,0);3,849(0,9);3,830(3,3);3,812(3,3);3,793(1,0);3,385(0,5);3,370(0,7);3,320
(1057,6);2,675(2,2);2,670(3,0);2,665(2,3);2,523(7,4);2,510(181,1);2,505(376,4);2,501(
504,7);2,496(370,6);2,492(182,8);2,332(2,2);2,328(3,0);2,323(2,2);1,250(3,6);1,232(8,
2);1,213(3,5);0,008(0,9);0,000(28,9);-0,008(1,2)

Ví dụ I-16: logP (trung tính): 3,17 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=
9,310(4,6);8,864(6,6);8,710(3,9);8,688(5,0);8,515(5,1);8,493(4,5);8,323(3,8);8,308(1,5
);7,803(3,5);7,798(1,4);7,787(1,8);7,781(6,9);7,775(1,1);7,740(0,9);7,733(6,6);7,728(1,
9);7,716(1,3);7,711(3,7);3,977(16,0);3,848(1,1);3,830(3,5);3,811(3,6);3,793(1,2);3,345
(291,1);3,340(207,5);3,329(264,8);3,328(285,2);2,676(1,0);2,672(1,4);2,667(1,0);2,663
(0,5);2,542(0,6);2,525(3,8);2,520(6,1);2,512(79,3);2,507(163,8);2,503(217,6);2,498(15
8,0);2,494(76,6);2,339(0,4);2,334(1,0);2,329(1,4);2,325(1,0);1,251(3,9);1,232(8,9);1,2
14(3,9);0,000(6,7)

Ví dụ I-17: logP (trung tính): 2,06 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=
9,314(3,7);8,965(2,4);8,958(2,4);8,920(7,7);8,721(3,3);8,699(4,2);8,660(1,8);8,656(1,9
);8,648(1,9);8,644(1,9);8,523(4,0);8,501(3,5);8,331(3,9);8,199(1,0);8,196(1,2);8,193(1,
1);8,189(1,0);8,179(1,1);8,175(1,2);8,172(1,3);8,168(1,1);7,654(1,3);7,653(1,3);7,642(
1,2);7,641(1,3);7,634(1,2);7,632(1,2);7,622(1,2);7,620(1,2);3,979(16,0);3,852(0,9);3,8
33(3,1);3,815(3,2);3,796(0,9);3,321(215,0);2,675(0,5);2,670(0,7);2,666(0,5);2,524(1,6)

;2,519(2,4);2,510(40,5);2,506(86,2);2,501(116,3);2,497(84,3);2,492(40,6);2,333(0,5);2,328(0,7);2,323(0,5);1,251(3,7);1,233(8,5);1,214(3,4);0,000(4,4)

Ví dụ I-18: logP (trung tính): 2,73 : ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=
9,309(4,6);8,713(5,2);8,710(4,5);8,688(3,8);8,499(3,8);8,477(3,2);8,329(4,8);7,753(0,9);7,733(1,9);7,717(1,0);7,713(1,0);7,627(0,4);7,610(0,9);7,592(1,3);7,579(0,8);7,575(0,7);7,559(1,4);7,536(1,6);7,515(0,7);7,447(1,2);7,429(1,9);7,412(0,9);3,977(16,0);3,850(1,1);3,832(3,5);3,813(3,6);3,795(1,2);3,387(0,3);3,324(445,6);2,671(1,2);2,506(151,2);2,502(197,0);2,497(156,1);2,328(1,2);2,073(1,4);1,249(3,9);1,230(8,4);1,212(3,7);0,000(4,5);-0,090(1,4)

Ví dụ I-19: logP (trung tính): 2,82 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=
9,311(1,8);8,866(2,8);8,712(1,1);8,690(1,4);8,516(1,4);8,494(1,2);8,324(1,9);7,798(1,6);7,776(2,2);7,671(2,2);7,649(1,6);3,978(5,9);3,850(0,5);3,832(1,4);3,813(1,4);3,795(0,6);3,743(0,4);3,725(0,6);3,651(16,0);2,671(0,3);2,506(41,8);2,502(54,1);2,498(43,2);1,251(1,4);1,232(3,0);1,214(1,4);0,000(19,7)

Ví dụ I-20: logP (trung tính): 3,13 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=
9,350(4,2);9,137(7,5);8,788(2,7);8,766(4,4);8,698(4,4);8,676(2,9);8,339(4,5);8,312(0,4);7,736(0,7);7,730(0,6);7,714(1,3);7,698(0,7);7,693(0,8);7,677(0,4);7,454(2,2);7,433(3,7);7,413(1,8);4,038(0,4);4,020(0,7);4,009(16,0);3,875(1,0);3,856(3,4);3,837(3,4);3,819(1,0);3,322(135,3);3,319(117,3);2,675(0,6);2,671(0,8);2,666(0,6);2,524(2,0);2,510(49,1);2,506(98,0);2,502(128,9);2,497(96,7);2,329(0,8);2,324(0,6);2,073(0,7);1,988(1,6);1,252(3,7);1,234(8,2);1,215(3,6);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,008(1,0);0,000(29,7)

Ví dụ I-21: logP (trung tính): 3,71 : ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=
9,326(4,8);8,875(3,2);8,853(3,7);8,572(3,8);8,550(3,5);8,349(5,0);7,946(4,5);7,924(5,6);7,735(5,5);7,713(4,6);3,991(16,0);3,894(1,1);3,876(3,5);3,857(3,6);3,839(1,1);3,332(358,8);2,671(0,6);2,506(81,6);2,502(105,3);2,498(80,8);2,329(0,6);1,265(3,7);1,247(8,1);1,228(3,7);0,000(2,2)

Ví dụ I-22: logP (trung tính): 3,44 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=
9,310(1,5);8,782(1,2);8,760(1,5);8,559(1,4);8,537(1,2);8,332(1,4);7,627(6,2);3,965(5,6);3,842(0,4);3,823(1,2);3,805(1,2);3,786(0,4);3,349(49,6);3,339(37,4);3,332(31,4);2,52

5(0,5);2,512(12,3);2,508(24,2);2,503(31,3);2,499(23,0);2,494(11,6);2,072(16,0);1,246(1,3);1,227(3,0);1,209(1,3);0,000(2,4)

Ví dụ I-23: logP (trung tính): 4,64 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,346(3,7);8,820(3,9);8,813(4,1);8,699(3,3);8,677(4,3);8,512(4,2);8,490(3,6);8,345(0,3);8,338(3,9);8,336(3,8);8,313(0,4);8,104(1,7);8,099(2,9);8,095(1,7);8,017(1,0);8,014(1,6);8,010(1,0);7,999(1,1);7,995(1,8);7,992(1,1);7,576(0,9);7,556(2,4);7,537(2,1);7,525(1,5);7,522(2,0);7,517(1,6);7,505(0,7);7,500(0,8);7,497(0,6);7,315(3,5);7,308(3,6);4,432(0,4);4,095(1,0);4,007(16,0);3,857(0,9);3,839(3,1);3,820(3,2);3,802(0,9);3,321(107,8);2,680(0,3);2,675(0,7);2,671(1,0);2,666(0,7);2,524(2,6);2,519(4,2);2,511(60,2);2,506(127,2);2,502(170,9);2,497(121,7);2,493(57,0);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);1,260(3,4);1,241(8,0);1,223(3,3);0,146(0,4);0,008(3,7);0,000(114,6);-0,009(4,2);-0,150(0,4)

Ví dụ I-24: logP (trung tính): 2,80 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,348(4,2);8,840(4,0);8,833(4,1);8,728(3,5);8,706(4,2);8,701(2,3);8,697(2,3);8,689(2,3);8,686(2,2);8,446(4,1);8,424(3,7);8,341(4,5);8,314(0,5);8,139(2,2);8,135(2,1);8,118(2,4);8,115(2,2);7,545(2,2);7,534(2,1);7,525(2,0);7,513(2,0);7,184(4,0);7,177(4,1);4,018(16,0);3,859(0,9);3,841(3,3);3,822(3,3);3,804(1,0);3,316(90,6);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(4,0);2,510(81,8);2,506(166,2);2,501(227,2);2,497(168,8);2,493(81,2);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(0,9);2,073(0,5);1,260(3,5);1,241(8,1);1,223(3,4);0,146(0,6);0,008(5,3);0,000(147,0);-0,008(5,0);-0,150(0,6)

Ví dụ I-25: logP (trung tính): 5,23 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,360(4,9);9,136(7,4);8,724(3,3);8,702(3,8);8,512(3,8);8,490(3,2);8,340(5,2);8,313(0,4);8,172(1,7);8,167(1,8);8,154(1,7);8,149(1,8);8,040(0,9);8,035(0,9);8,029(1,0);8,023(1,0);8,019(1,1);8,013(1,1);8,007(1,0);8,002(0,9);7,671(1,7);7,649(2,9);7,626(1,5);4,020(16,0);3,885(1,1);3,867(3,5);3,848(3,6);3,830(1,1);3,320(222,3);2,671(1,0);2,506(121,5);2,502(161,9);2,498(125,0);2,329(1,0);2,073(3,6);1,264(3,7);1,245(8,1);1,227(3,7);0,146(0,7);0,000(130,8);-0,150(0,6)

Ví dụ I-26: logP (trung tính): 2,43 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=

9,668(7,7);9,367(4,6);9,283(0,4);8,818(3,3);8,796(3,9);8,772(1,7);8,762(1,7);8,461(3,8);8,440(3,6);8,351(4,9);8,318(0,4);8,312(0,8);8,237(2,0);8,218(2,5);8,035(1,0);8,031(1,

0);8,016(1,8);8,012(1,8);7,997(1,0);7,992(1,0);7,570(1,2);7,558(1,3);7,551(1,3);7,539(1,1);4,140(1,3);4,087(0,4);4,042(16,0);3,908(1,0);3,890(3,5);3,871(3,5);3,852(1,2);3,315(285,7);2,670(2,0);2,505(255,8);2,501(349,9);2,497(265,6);2,328(2,1);2,073(1,1);1,276(3,7);1,257(8,2);1,239(3,8);-0,001(4,4)

Ví dụ I-27: logP (trung tính): 2,54 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

9,696(6,7);9,368(4,9);9,347(3,1);9,342(3,1);8,821(3,3);8,799(3,7);8,749(2,1);8,746(2,0);8,737(2,1);8,734(2,0);8,510(1,2);8,506(1,8);8,491(1,3);8,486(1,8);8,460(3,7);8,438(3,4);8,350(5,2);7,635(1,5);7,622(1,5);7,615(1,5);7,603(1,4);4,035(16,0);3,904(1,1);3,885(3,5);3,867(3,6);3,849(1,1);3,319(112,4);2,671(0,9);2,506(119,0);2,502(149,9);2,498(112,5);2,328(0,9);2,073(1,4);1,273(3,9);1,254(8,4);1,236(3,7);0,146(0,6);0,007(7,0);0,000(116,0);-0,150(0,6)

Ví dụ I-28: logP (trung tính): 3,38 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

10,198(0,4);9,323(3,8);9,058(2,7);9,052(2,7);8,565(5,5);8,538(3,3);8,517(4,4);8,363(3,9);8,341(3,3);8,314(4,3);8,312(4,1);7,953(0,4);7,882(0,7);7,878(0,8);7,862(1,5);7,860(1,4);7,842(0,8);7,839(0,8);7,552(0,4);7,536(1,3);7,531(1,9);7,527(1,0);7,513(2,5);7,511(2,4);7,505(1,5);7,500(1,2);7,496(1,0);7,428(1,0);7,421(0,9);7,414(0,5);7,407(1,2);7,402(1,1);7,393(0,5);7,390(0,5);7,386(0,6);5,755(3,2);3,956(16,0);3,818(0,9);3,800(3,2);3,781(3,3);3,763(1,0);3,319(43,5);2,891(3,2);2,732(2,5);2,676(0,3);2,672(0,4);2,525(1,1);2,520(1,8);2,512(22,2);2,507(45,3);2,502(61,5);2,498(44,1);2,493(20,1);2,329(0,4);1,246(3,4);1,227(8,0);1,209(3,3);0,008(1,4);0,000(38,1);-0,009(1,1)

Ví dụ I-29: logP (trung tính): 3,50 : ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

9,340(9,3);8,886(0,8);8,789(11,6);8,558(2,9);8,536(3,6);8,519(5,8);8,477(0,4);8,471(0,4);8,316(5,2);8,290(2,9);8,050(12,8);8,002(2,2);7,990(2,4);7,985(1,6);7,980(2,5);7,968(2,4);7,914(0,9);7,897(0,6);7,888(5,3);7,876(5,6);7,870(3,5);7,865(6,0);7,853(5,7);7,767(0,5);7,755(0,5);7,749(0,4);7,744(0,5);7,734(0,6);7,645(1,1);7,627(2,1);7,615(1,5);7,598(1,6);7,574(1,1);7,566(1,3);7,557(1,0);7,550(1,2);7,537(0,4);7,530(0,4);7,422(2,3);7,416(1,3);7,406(6,3);7,401(5,8);7,384(10,1);7,362(4,9);7,339(1,1);7,322(0,4);7,301(0,4);7,279(0,7);7,257(0,4);6,540(0,4);5,754(3,1);3,985(0,5);3,965(16,0);3,813(1,0);3,794(3,4);3,775(3,4);3,757(1,0);3,568(1,3);3,318(38,0);2,696(0,4);2,671(1,0);2,524(2,8);2,50

6(126,9);2,502(171,7);2,498(130,6);2,333(0,8);2,329(1,0);1,247(3,8);1,229(8,5);1,210(3,7);0,008(1,6);-0,001(41,9)

Ví dụ I-30: logP (trung tính): 2,73 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

9,334(4,5);9,266(2,8);9,260(2,9);8,809(3,3);8,802(3,4);8,645(2,0);8,624(7,0);8,616(2,4);8,613(2,3);8,599(4,9);8,578(2,0);8,410(1,1);8,407(1,4);8,404(1,3);8,389(1,2);8,386(1,4);8,383(1,4);8,328(4,8);8,314(0,4);7,650(1,5);7,639(1,5);7,630(1,5);7,618(1,4);7,312(3,5);7,305(3,7);5,754(6,7);3,967(16,0);3,846(1,0);3,827(3,5);3,809(3,5);3,790(1,1);3,318(66,1);2,671(0,9);2,667(0,7);2,506(109,6);2,502(146,9);2,498(115,5);2,329(0,9);1,253(3,7);1,234(8,3);1,216(3,6);0,000(33,2)

Ví dụ I-31: logP (trung tính): 3,81 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

10,196(0,7);9,356(4,0);9,301(0,5);9,273(0,4);9,267(0,4);8,813(0,4);8,807(0,4);8,770(3,6);8,749(4,2);8,533(3,9);8,512(3,4);8,408(0,4);8,389(0,4);8,344(4,2);8,314(0,9);8,280(0,5);8,198(0,3);8,048(6,6);8,020(2,0);8,011(2,5);8,002(2,5);7,996(2,3);7,988(0,3);7,643(0,4);7,627(0,5);7,609(0,3);7,598(0,3);7,572(1,1);7,564(3,4);7,561(3,3);7,553(4,9);7,547(5,3);7,538(0,6);7,339(0,4);7,333(0,4);5,754(2,6);4,542(1,7);3,990(16,0);3,937(0,4);3,877(1,1);3,872(1,2);3,858(3,3);3,839(3,4);3,821(1,0);3,317(208,5);2,675(1,5);2,671(2,1);2,666(1,5);2,524(5,3);2,519(8,2);2,510(112,3);2,506(235,3);2,501(328,1);2,497(243,9);2,492(116,8);2,337(0,7);2,333(1,4);2,328(2,0);2,324(1,5);1,261(3,7);1,242(8,5);1,224(3,7);0,146(0,7);0,008(5,8);0,000(178,0);-0,009(6,4);-0,150(0,7)

Ví dụ I-32: logP (trung tính): 3,52 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

9,102(9,2);8,936(2,3);8,932(2,4);8,795(2,5);8,773(4,7);8,726(7,0);8,722(2,8);8,703(2,7);7,683(0,7);7,679(0,7);7,664(1,4);7,660(1,5);7,645(0,8);7,640(0,8);7,589(0,4);7,583(0,6);7,580(0,7);7,566(0,7);7,563(0,9);7,558(0,6);7,549(0,6);7,545(0,5);7,521(1,0);7,518(1,1);7,500(0,7);7,495(1,2);7,492(1,1);7,474(0,6);7,471(0,6);7,426(1,0);7,423(0,9);7,407(1,5);7,404(1,4);7,388(0,7);7,384(0,7);5,754(0,6);4,039(0,6);4,021(0,6);3,910(16,0);3,896(3,3);3,878(3,2);3,859(0,9);3,318(29,5);2,524(0,6);2,511(17,0);2,507(36,1);2,502(48,5);2,497(34,5);2,493(16,1);1,989(2,5);1,268(3,3);1,250(7,7);1,231(3,4);1,193(0,7);1,175(1,4);1,158(0,7);0,146(0,3);0,008(2,7);0,000(79,3);-0,009(2,7);-0,150(0,3)

Ví dụ I-33: logP (trung tính): 3,52 ¹H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ=

8,923(2,5);8,920(2,7);8,868(7,6);8,718(5,7);8,713(2,9);8,695(3,9);8,506(3,8);8,483(3,3)

);7,805(0,4);7,798(4,0);7,793(1,4);7,781(1,6);7,776(5,8);7,768(0,7);7,679(0,7);7,671(5,7);7,666(1,7);7,654(1,4);7,649(4,1);7,642(0,4);5,755(9,6);3,896(16,0);3,882(3,3);3,863(3,3);3,845(1,0);3,320(35,8);2,676(0,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,525(1,3);2,511(27,8);2,507(57,7);2,502(80,1);2,498(59,9);2,494(29,1);2,333(0,3);2,329(0,5);2,324(0,3);1,398(0,5);1,266(3,5);1,248(7,8);1,230(3,6);0,008(2,5);0,000(67,3);-0,008(2,4)

Ví dụ I-34: logP (trung tính): 3,62 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,072(8,5);8,768(2,6);8,746(4,7);8,694(4,6);8,672(2,8);8,158(2,6);8,002(1,7);7,981(2,1);7,762(1,4);7,758(1,5);7,740(1,2);7,737(1,2);7,683(0,7);7,679(0,8);7,663(1,4);7,659(1,6);7,644(0,8);7,640(0,9);7,587(0,4);7,582(0,6);7,578(0,7);7,575(0,6);7,561(0,9);7,556(0,6);7,548(0,6);7,543(0,5);7,520(1,0);7,516(1,1);7,499(0,7);7,494(1,2);7,490(1,2);7,473(0,6);7,469(0,6);7,425(1,0);7,422(0,9);7,405(1,5);7,387(0,7);7,383(0,7);5,753(9,3);3,940(0,9);3,921(3,2);3,902(4,4);3,897(16,0);3,885(1,2);3,322(38,9);2,524(0,6);2,511(15,6);2,507(33,1);2,502(44,5);2,497(32,0);2,493(15,3);1,988(0,6);1,398(0,4);1,259(3,5);1,241(7,8);1,222(3,3);1,175(0,3);0,008(2,3);0,000(68,7);-0,009(2,6)

Ví dụ I-35: logP (trung tính): 3,16 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,653(6,9);9,175(13,7);9,022(10,3);8,720(5,8);8,699(7,3);8,481(7,0);8,459(6,1);8,411(6,8);7,697(1,4);7,694(1,6);7,678(3,0);7,674(3,3);7,659(1,7);7,655(1,8);7,602(0,6);7,598(0,6);7,589(0,7);7,581(1,5);7,563(2,0);7,559(1,4);7,550(1,2);7,546(1,2);7,519(2,3);7,496(2,6);7,474(1,3);7,426(2,1);7,408(3,4);7,386(1,5);4,221(2,0);4,203(6,6);4,184(6,7);4,166(2,0);3,319(59,0);2,675(1,4);2,671(1,9);2,667(1,5);2,541(1,3);2,524(4,7);2,506(246,0);2,502(324,7);2,498(236,9);2,333(1,4);2,329(1,9);1,301(7,3);1,282(16,0);1,263(7,2);1,234(0,4);0,146(1,0);0,008(7,9);0,000(220,7);-0,007(9,4);-0,149(1,1)

Các giá trị logP được xác định theo hướng dẫn EEC số 79/831 Annex V.A8 bằng HPLC (sắc ký lỏng hiệu năng cao - high-performance liquid chromatography) trên cột pha đảo (C 18). Nhiệt độ: 55°C.

Việc xác định LC-MS trong khoảng axit được thực hiện ở độ pH 2,7 sử dụng dung dịch nước axit formic 0,1% và axetonitril (chứa 0,1% axit formic) làm pha động; gradien tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. logP (HCOOH) được nêu trong bảng.

Việc xác định LC-MS trong khoảng trung tính được thực hiện ở pH=7,8 với dung dịch nước amoni hydrocacbonat 0,001M và axetonitril làm pha động; gradien tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril. logP (trung tính) được nêu trong bảng.

Việc hiệu chỉnh được thực hiện bằng cách sử dụng các alkan-2-on không phân nhánh (có 3 đến 16 nguyên tử cacbon) với các trị số logP đã biết (trị số logP được xác định trên cơ sở thời gian lưu bằng cách nội suy tuyến tính giữa hai alkanon liên tiếp).

Dữ liệu NMR của các ví dụ được chọn được liệt kê dưới dạng thông thường (trị số δ , tách đa bội, số nguyên tử hydro) hoặc dưới dạng các danh sách đỉnh NMR.

Trong mỗi trường hợp, dung môi trong đó phổ NMR được ghi được nêu rõ.

Phương pháp liệt kê đỉnh NMR

Dữ liệu ^1H NMR của các ví dụ được chọn được đưa ra dưới dạng danh sách đỉnh ^1H NMR. Đối với mỗi một đỉnh tín hiệu, trước tiên, trị số δ tính bằng ppm và sau đó, cường độ tín hiệu nằm trong dấu ngoặc đơn được liệt kê. Cặp trị số δ –số cường độ tín hiệu đối với các đỉnh tín hiệu khác nhau được liệt kê với sự phân cách nhau bằng dấu chấm phẩy.

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

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

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

Việc hiệu chỉnh sự chuyển dịch hóa học của phổ ^1H NMR được thực hiện bằng cách sử dụng tetrametylsilan và/hoặc sự chuyển dịch hóa học của dung môi, nhất là trong trường hợp phổ được đo trong DMSO. Do đó, đỉnh tetrametylsilan có thể nhưng không nhất thiết xuất hiện trong các danh sách liệt kê đỉnh NMR.

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

Ngoài ra, giống như dữ liệu ^1H NMR in ra thông thường, các danh sách nêu trên có thể thể hiện các tín hiệu về dung môi, các tín hiệu về chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích mà cũng được đề xuất bởi sáng chế, và/hoặc các đỉnh của các tạp chất.

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

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

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

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

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

Các ví dụ ứng dụng

Ctenocephalides felis - thử nghiệm tiếp xúc in vitro với bọ chét mèo trưởng thành

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

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

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu ít nhất đạt được hiệu quả 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm². Hiệu quả 100% có nghĩa là, toàn bộ bọ chết bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là, không có bọ chết nào bị tổn thương.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất dưới đây từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm² (500 g/ha): I-1, I-15, I-18, I-24

Boophilus microplus – Thử nghiệm tiêm

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra dạng điều chế của hoạt chất thích hợp, 10 mg hoạt chất được trộn với 0,5 ml dung môi và dịch cô đặc được pha loãng với dung môi đến nồng độ mong muốn.

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

Hiệu quả được đánh giá sau thời gian 7 ngày bằng cách cho đẻ trứng có khả năng sinh sản. Các trứng mà rõ ràng là không có khả năng sinh sản được bảo quản trong ngăn được kiểm soát khí hậu cho tới khi ấu trùng nở sau thời gian khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% có nghĩa là không có con tích nào đẻ trứng hữu cơ khả năng sinh sản; 0% có nghĩa là, tất cả các trứng đều có khả năng sinh sản.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 95% với tỷ lệ áp dụng 20 µg/động vật: I-3, I-18

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng 20 µg/động vật: I-12

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 80% với tỷ lệ áp dụng 20 µg/động vật: I-1, I-15, I-19, I-32

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra dạng điều chế thích hợp của hoạt chất, 10 mg hoạt chất được trộn với 0,5 ml dimetyl sulfoxit. Tiến hành pha loãng bằng máu gia súc đã xử lý bằng xitrat để thu được nồng độ mong muốn.

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

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là, tất cả số bộ chết đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là, không có bộ chết nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-1, I-3, I-7, I-12, I-15, I-16, I-18, I-19, I-23, I-28, I-29, I-32

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 95% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-17

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-6

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-21

Thử nghiệm với *Lucilia cuprina*

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra dạng điều chế của hoạt chất thích hợp, 10 mg hoạt chất được trộn với 0,5 ml dimetyl sulfoxit và dịch cô đặc được pha loãng với dung môi đến nồng độ mong muốn.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-1, I-2, I-3, I-6, I-7, I-12, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-21, I-23, I-24, I-28, I-29, I-30, I-32

Thử nghiệm với ruồi nhà *Musca domestica*

Dung môi: dimethyl sulfoxit

Để tạo ra dạng điều chế của hoạt chất thích hợp, 10 mg hoạt chất được trộn với 0,5 ml dimethyl sulfoxit và dịch cô đặc được pha loãng với dung môi đến nồng độ mong muốn.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-32

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-2, I-3

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 85% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-18

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-1, I-16, I-19

Thử nghiệm với tuyến trùng nốt sùng (*Meloidogyne incognita*)

Dung môi: 125,0 phần trọng lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất phù hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được trộn với lượng dung môi đã định, và thể đặc này được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Các chậu được đổ cát, dung dịch hoạt chất, huyền phù chứa trứng/ấu trùng của tuyến trùng nốt sùng (*Meloidogyne incognita*) và hạt rau diếp. Hạt rau diếp nảy mầm và các cây phát triển. Các nốt sần phát triển ở rễ.

Sau 14 ngày, xác định % hiệu quả diệt tuyến trùng do việc hình thành các nốt sần. 100% có nghĩa là không phát hiện được nốt sần nào; 0% có nghĩa là số nốt sần ở thực vật được xử lý tương ứng với mẫu đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: I-15, I-17, I-33

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: I-8, I-30

Myzus persicae – thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần trọng lượng axeton
1,5 phần khối lượng của dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan với các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

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

Sau thời gian 5-6 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả các con rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không con rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-8, I-30

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1, I-3, I-17, I-18, I-26, I-29, I-32, I-33

Phaedon cochleariae- Thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton
 1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan với các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1, I-2, I-3, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-32, I-33, I-34, I-35

Spodoptera frugiperda– Thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton
 1,5 phần khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan với các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-7, I-8, I-9, I-12, I-15, I-16, I-18, I-19, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-6

Tetranychus urticae – Thử nghiệm phun, kháng OP

Dung môi: 78,0 phần trọng lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan với các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng với nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

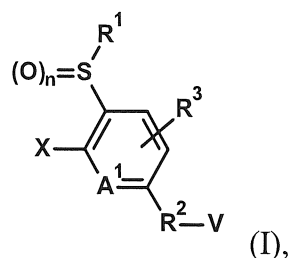
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-1

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-17, I-33

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-15

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):

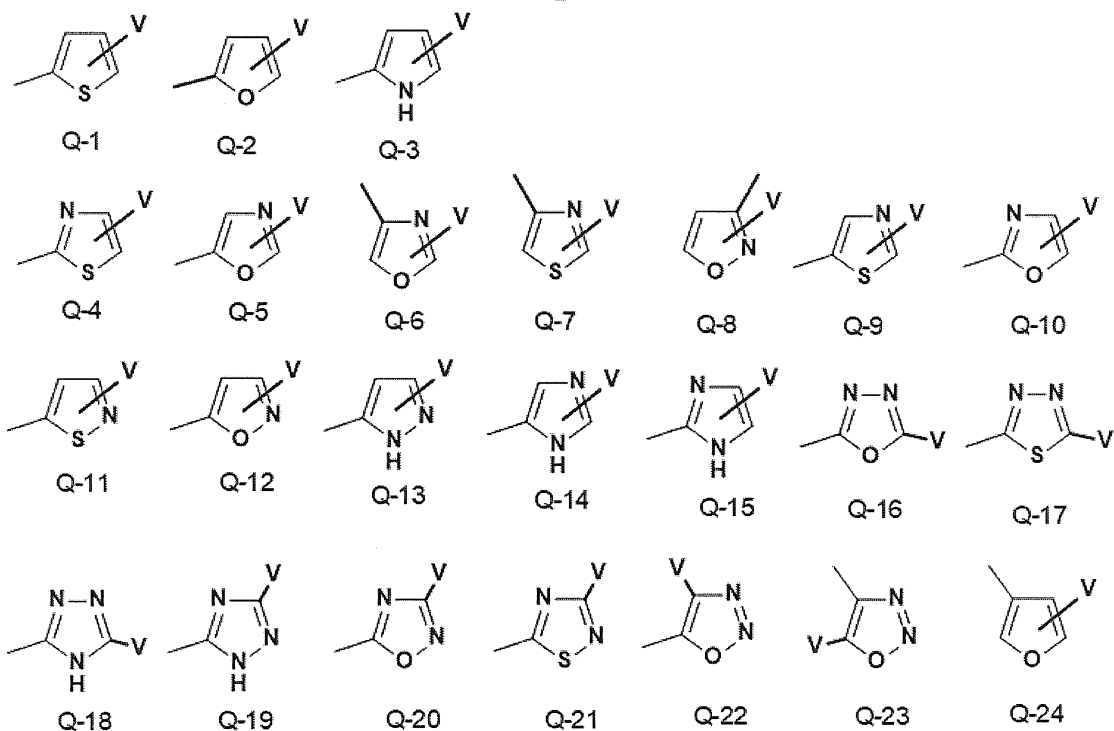


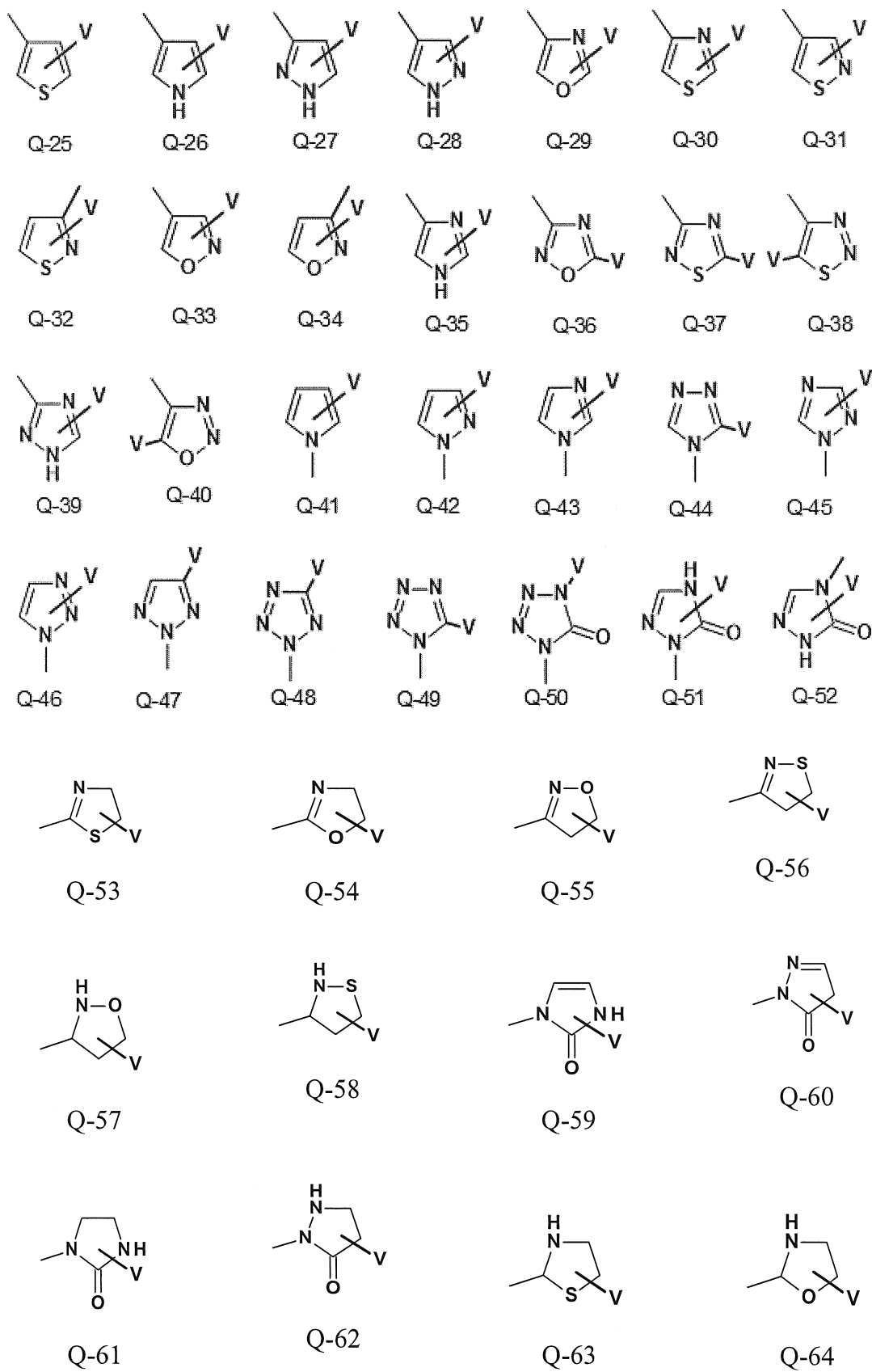
trong đó,

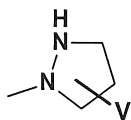
A^1 là nitơ hoặc $=C(R^4)-$,

R^1 là (C_1-C_4) -alkyl, (C_1-C_4) hydroxyalkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfinyl- (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkylsulfonyl- (C_1-C_4) alkyl,

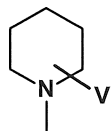
R^2-V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm từ Q-1 đến Q-80, trong đó các phần tử thế tùy ý trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy,



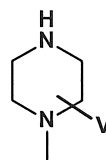




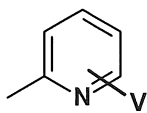
Q-65



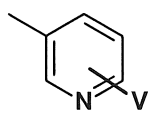
Q-66



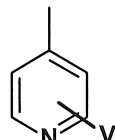
Q-67



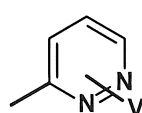
Q-68



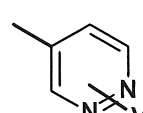
Q-69



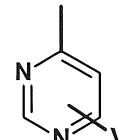
Q-70



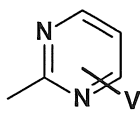
Q-71



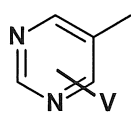
Q-72



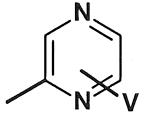
Q-73



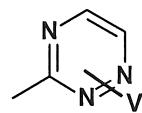
Q-74



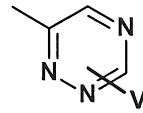
Q-75



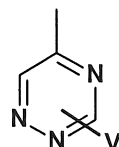
Q-76



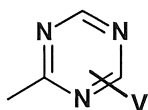
Q-77



Q-78



Q-79



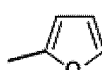
Q-80

trong đó,

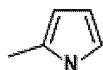
V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ nhóm bao gồm từ V-1 đến V-101, trong đó các phần tử thế tùy ý trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,



V-1



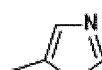
V-2



V-3



V-4



V-5



V-6



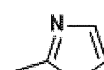
V-7



V-8



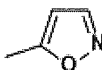
V-9



V-10



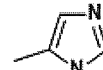
V-11



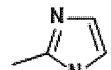
V-12



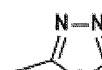
V-13



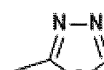
V-14



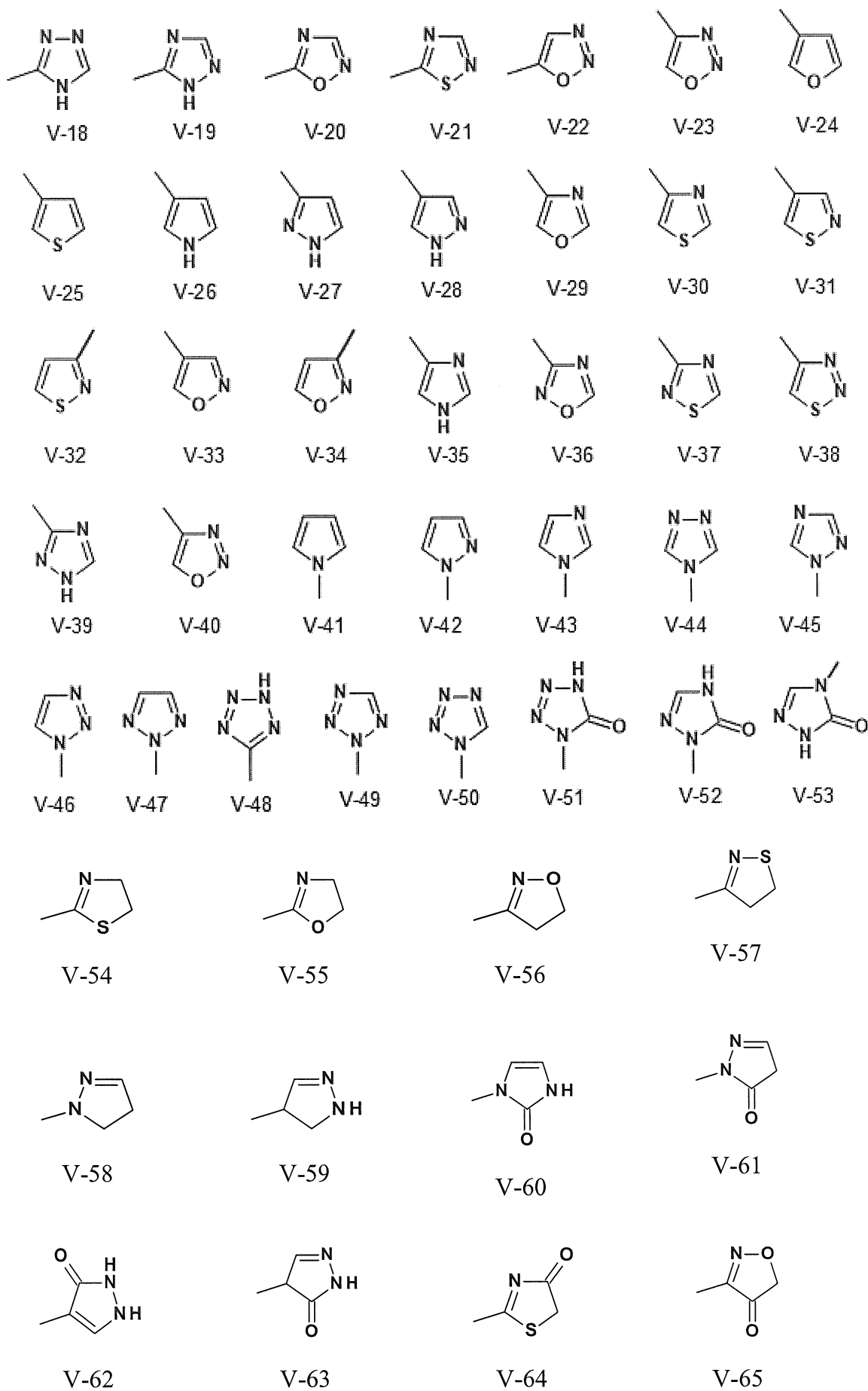
V-15

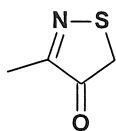


V-16

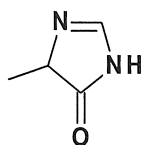


V-17

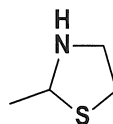




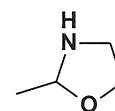
V-66



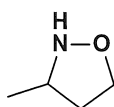
V-67



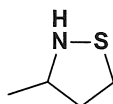
V-68



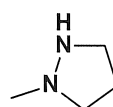
V-69



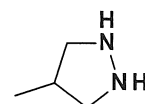
V-70



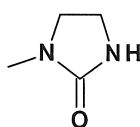
V-71



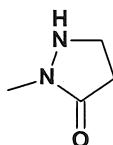
V-72



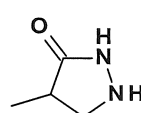
V-73



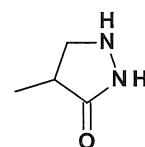
V-74



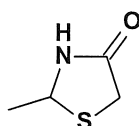
V-75



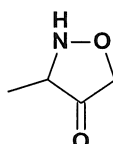
V-76



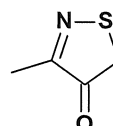
V-77



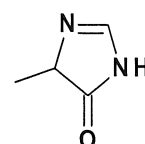
V-78



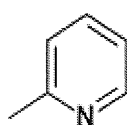
V-79



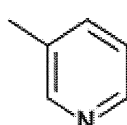
V-80



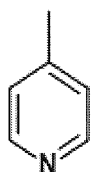
V-81



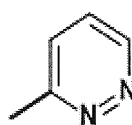
V-82



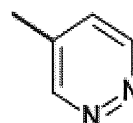
V-83



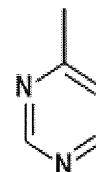
V-84



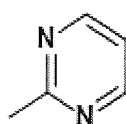
V-85



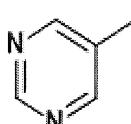
V-86



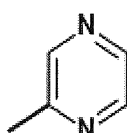
V-87



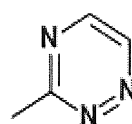
V-88



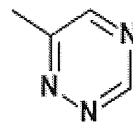
V-89



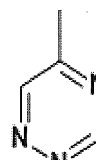
V-90



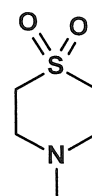
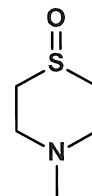
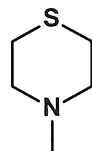
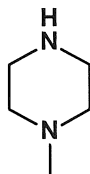
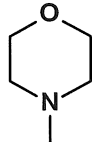
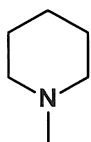
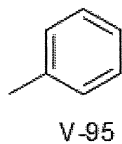
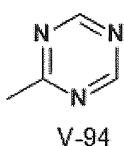
V-91



V-92



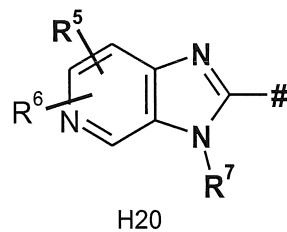
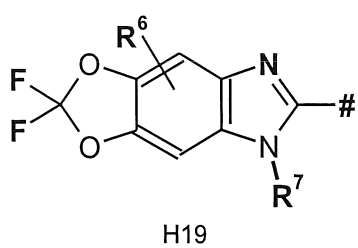
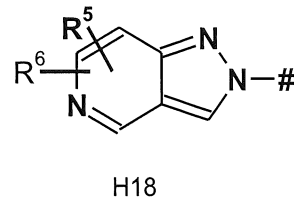
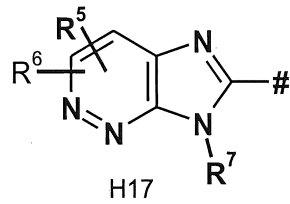
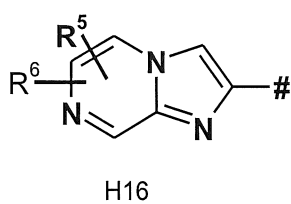
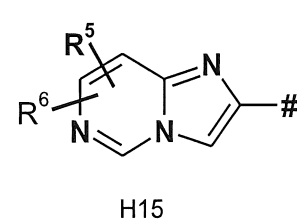
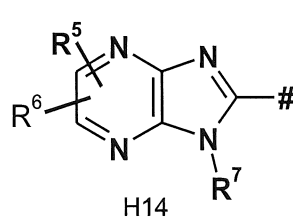
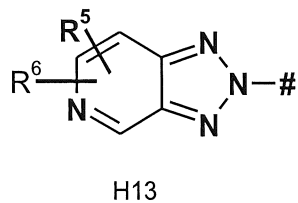
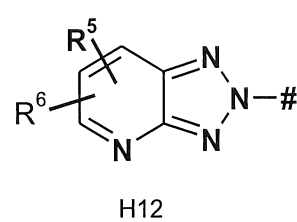
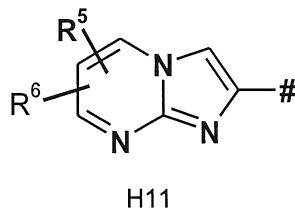
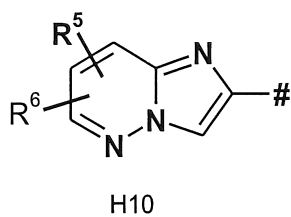
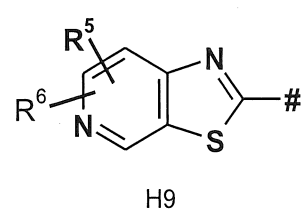
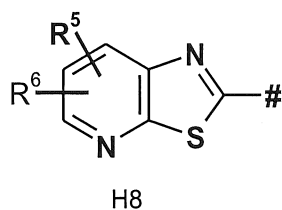
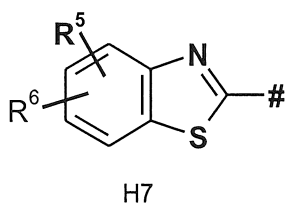
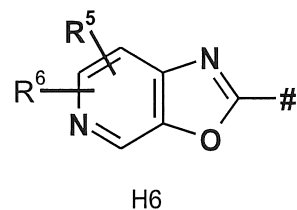
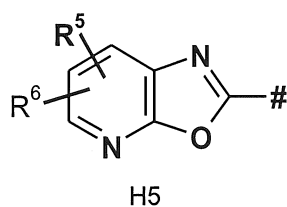
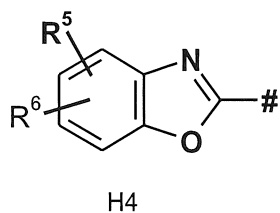
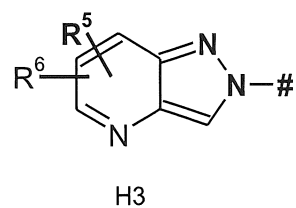
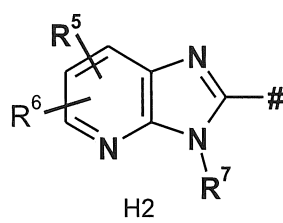
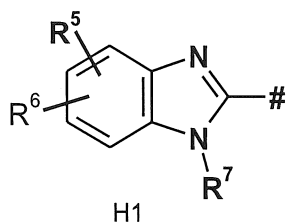
V-93



R^3 là hydro, xyano, halogen, nitro, hydroxy, amino, SCN, tri-(C_1 - C_4)alkylsilyl, (C_3 - C_6)xycloalkyl, (C_3 - C_6)xycloalkyl-(C_3 - C_6)xycloalkyl, (C_1 - C_4)alkyl-(C_3 - C_6)xycloalkyl, halo(C_3 - C_6)xycloalkyl, (C_1 - C_4)alkyl, (C_1 - C_4)haloalkyl, (C_1 - C_4)xyanoalkyl, (C_1 - C_4)alkoxy-(C_1 - C_4)alkyl, (C_2 - C_4)alkenyl, (C_2 - C_4)haloalkenyl, (C_2 - C_4)xyanoalkenyl, (C_2 - C_4)alkynyl, (C_2 - C_4)haloalkynyl, (C_2 - C_4)xyanoalkynyl, (C_1 - C_4)alkoxy, (C_1 - C_4)haloalkoxy, (C_1 - C_4)xyanoalkoxy, (C_1 - C_4)alkylhydroxyimino, (C_1 - C_4)alkoxyimino, (C_1 - C_4)alkyl-(C_1 - C_4)-alkoxyimino, (C_1 - C_4)alkylthio, (C_1 - C_4)haloalkylthio, (C_1 - C_4)alkylsulfinyl, (C_1 - C_4)haloalkylsulfinyl, (C_1 - C_4)alkylsulfonyl, (C_1 - C_4)haloalkyl-sulfonyl, (C_1 - C_4)alkylsulfonyloxy, (C_1 - C_4)alkylcarbonyl, (C_1 - C_4)-haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C_1 - C_4)alkylaminocarbonyl, di-(C_1 - C_4)-alkylaminocarbonyl, (C_1 - C_4)alkylsulfonylamino, (C_1 - C_4)alkylamino, di-(C_1 - C_4)alkylamino, aminosulfonyl, (C_1 - C_4)alkylaminosulfonyl, di-(C_1 - C_4)alkylaminosulfonyl hoặc $NHCO$ -(C_1 - C_4)alkyl ((C_1 - C_4)alkylcarbonyl-amino),

R^4 là hydro, halogen, xyano hoặc (C_1 - C_4)alkyl,

X là hệ vòng hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh được chọn từ nhóm bao gồm từ H1 đến H20,



R^5 , R^6 độc lập với nhau là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkoxyimino, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) haloalkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyloxy, (C_1-C_4) alkylcarbonyl, (C_1-C_4) haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C_1-C_4) alkylaminocarbonyl, di- (C_1-C_4) alkylaminocarbonyl, (C_1-C_4) alkylsulfonylamino, (C_1-C_4) alkylamino, di- (C_1-C_4) alkylamino, aminosulfonyl, (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl hoặc di- (C_1-C_4) alkylaminosulfonyl,

R^7 là (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) xyanoalkyl, (C_1-C_4) hydroxyalkyl, (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) alkenyl, (C_2-C_4) alkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkenyl, (C_2-C_4) xyanoalkenyl, (C_2-C_4) alkynyl, (C_2-C_4) alkynyloxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_4) haloalkynyl, (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_3-C_6) xycloalkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkyl- (C_3-C_6) xycloalkyl, halo- (C_3-C_6) xycloalkyl, (C_1-C_4) alkylthio- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfinyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl- (C_1-C_4) alkyl hoặc (C_1-C_4) alkylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

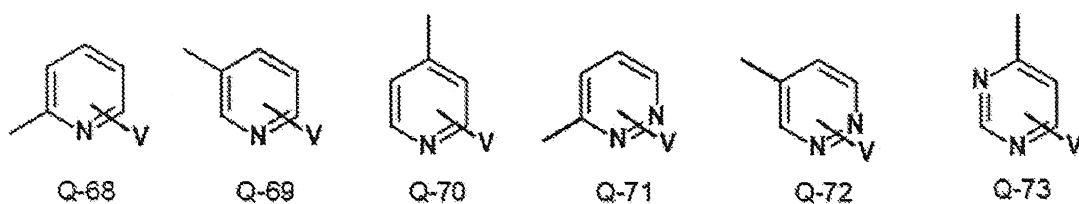
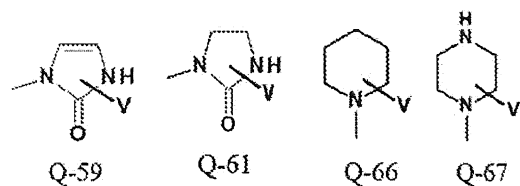
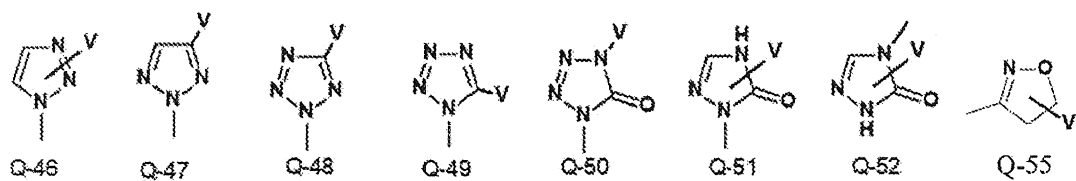
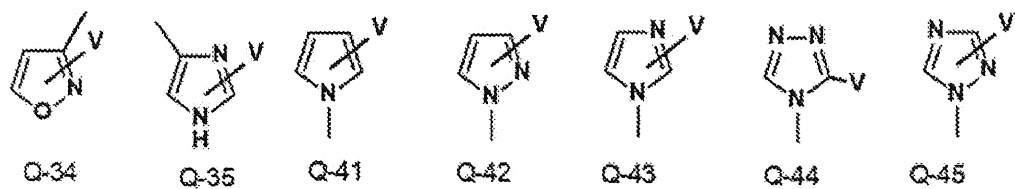
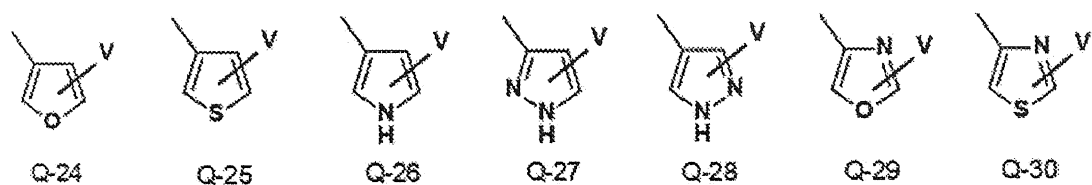
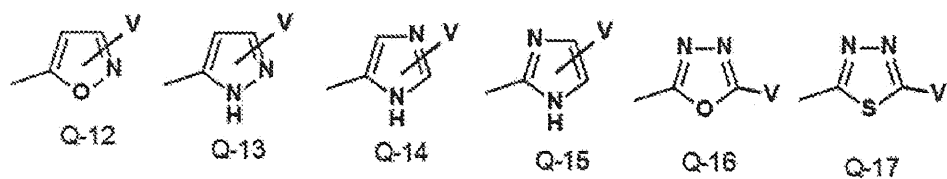
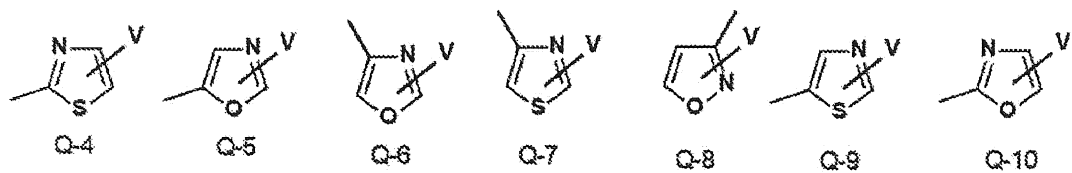
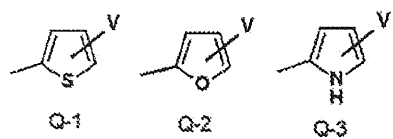
2. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó:

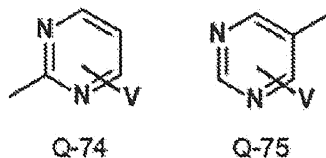
A^1 là nitơ hoặc $=C(R^4)-$,

R^1 là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^2-V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần được chọn từ nhóm bao gồm Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-13, Q-14, Q-15, Q-16, Q-17, Q-24, Q-25, Q-26, Q-27, Q-28, Q-29, Q-30, Q-34, Q-35, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-55, Q-59, Q-61, Q-66, Q-67, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73,

Q-74 hoặc Q-75,

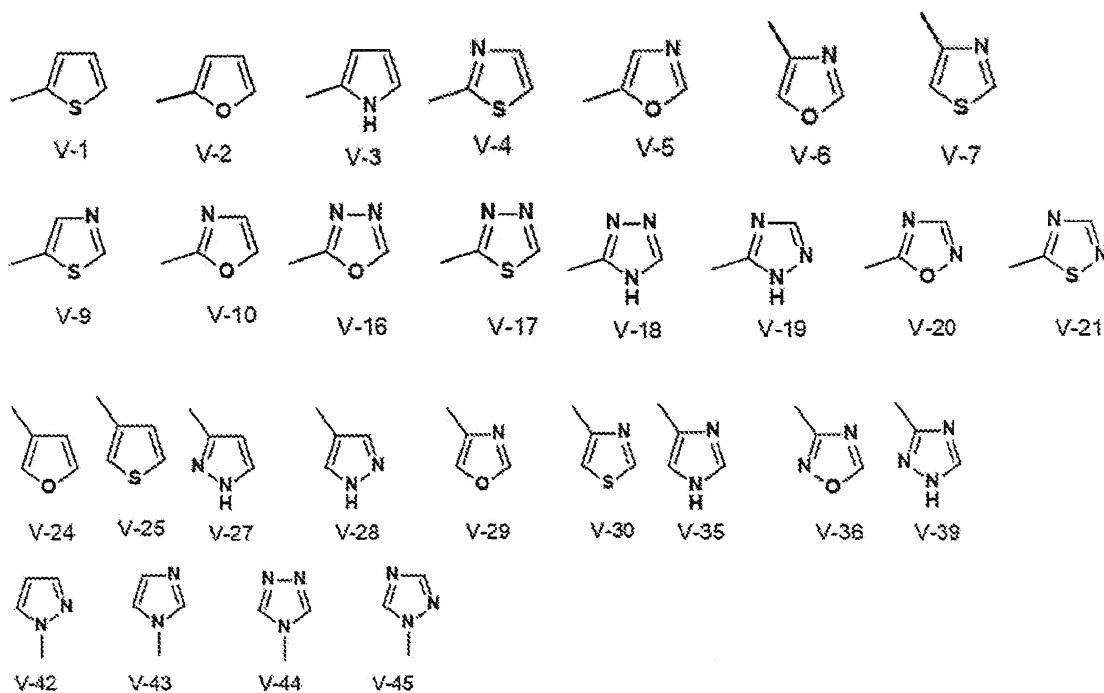


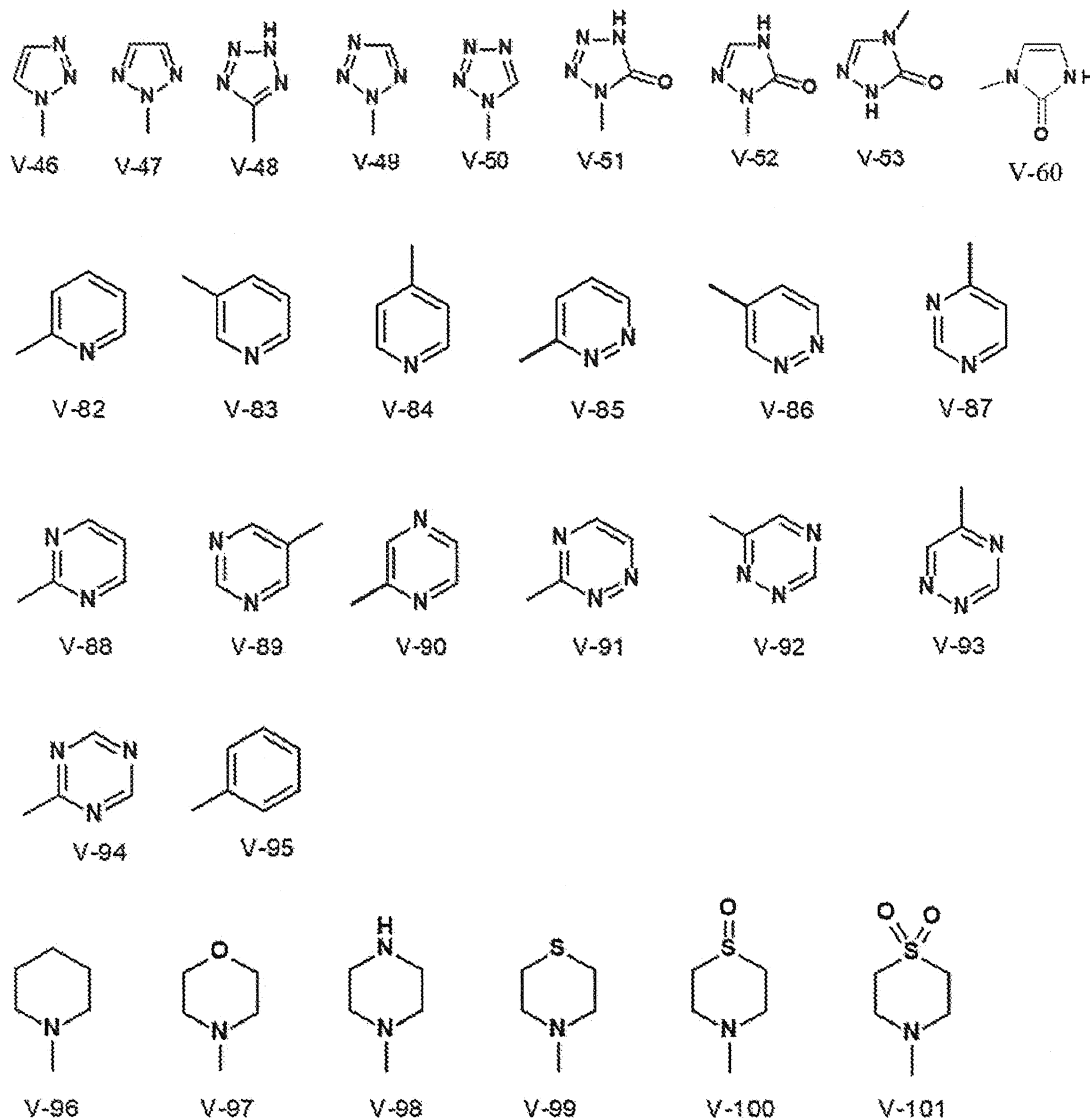


trong đó các phần tử thế tùy ý trong mỗi trường hợp là: xyano, flo, clo, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, triflometyl, metoxy hoặc triflometoxy,

trong đó,

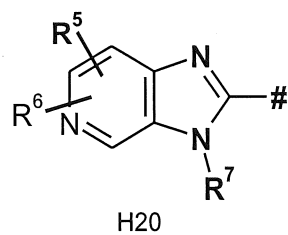
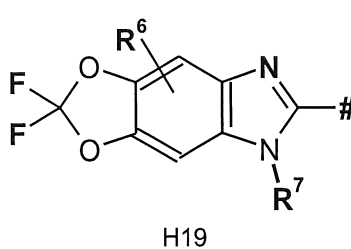
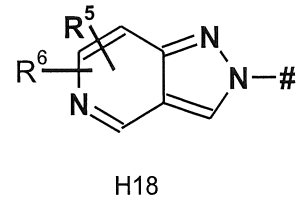
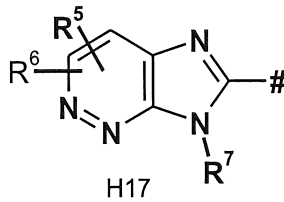
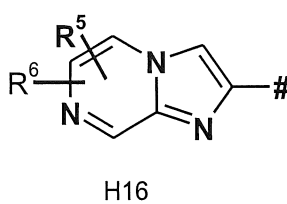
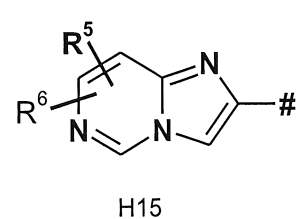
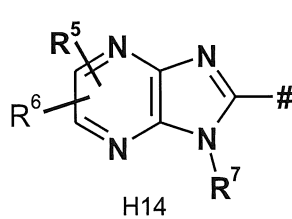
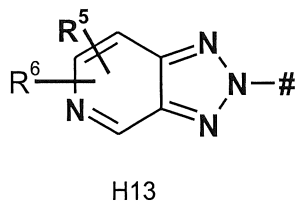
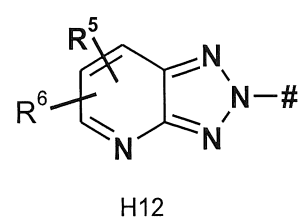
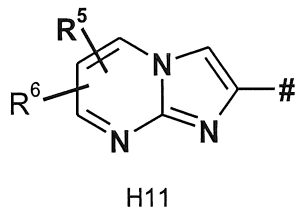
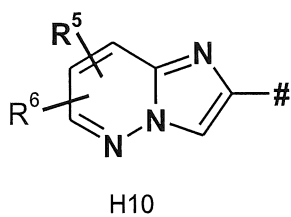
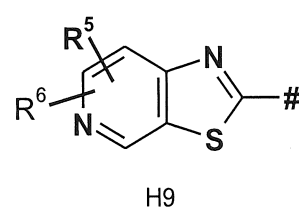
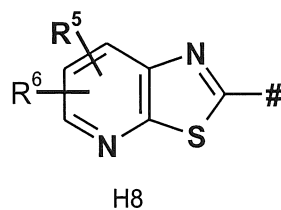
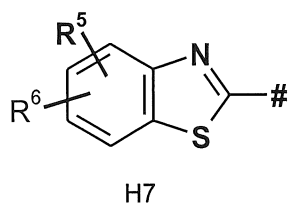
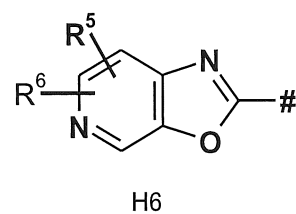
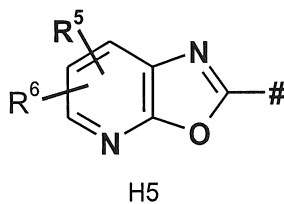
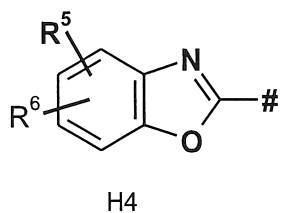
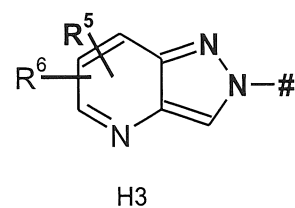
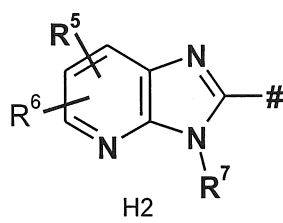
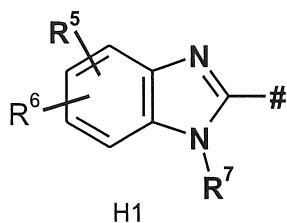
V là vòng tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, triflometyl, metoxy hoặc triflometoxy, được chọn từ nhóm bao gồm V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-6, V-7, V-9, V-10, V-16, V-17, V-18, V-19, V-20, V-21, V-24, V-25, V-27, V-28, V-29, V-30, V-35, V-36, V-39, V-42, V-43, V-44, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-52, V-53, V-60, V-82, V-83, V-84, V-85, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 hoặc V-101,





R^3 là hydro, xyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) haloalkoxy, (C_1-C_4) alkylthio, (C_1-C_4) alkylsulfinyl, (C_1-C_4) alkylsulfonyl, (C_1-C_4) -haloalkylthio, (C_1-C_4) haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) haloalkylsulfonyl hoặc $NHCO-(C_1-C_4)alkyl$ ($(C_1-C_4)alkylcarbonylamino$),

X là hệ vòng hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh được chọn từ nhóm bao gồm H1, H2, H3, H4, H5, H7, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19, hoặc H20,



R⁴ là hydro, flo, clo, brom hoặc xyano,

R^5 là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,

R^6 là hydro,

R^7 là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

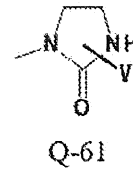
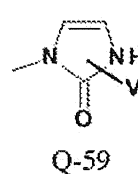
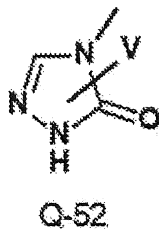
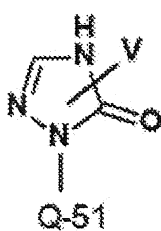
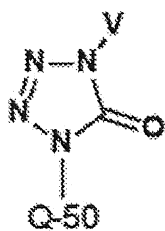
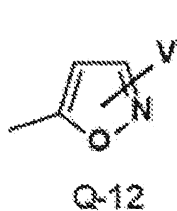
n bằng 0, 1 hoặc 2.

3. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó:

A^1 là nito,

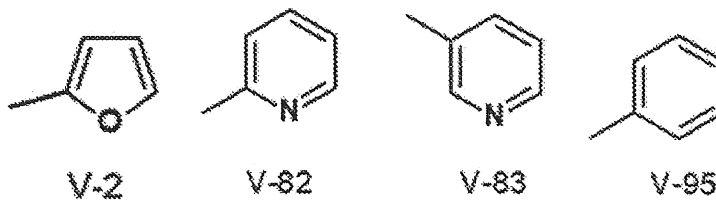
R^1 là etyl,

R^2 -V là vòng tùy ý được thế một lần bằng clo hoặc triflometyl được chọn từ nhóm bao gồm Q-12, Q-27, Q-28, Q-42, Q-45, Q-50, Q-51, Q-52, Q-59 hoặc Q-61,



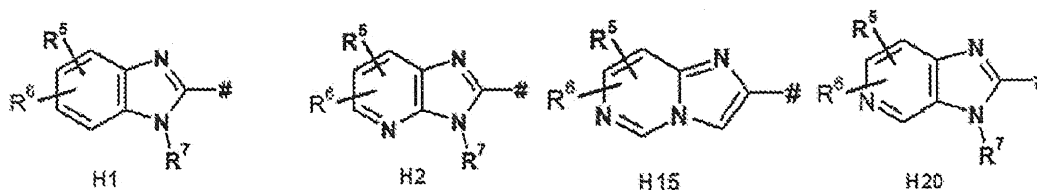
trong đó,

V là vòng tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ flo, clo hoặc brom, được chọn từ nhóm bao gồm V-2, V-82, V-83 hoặc V-95,



R^3 là hydro,

X là hệ vòng dị vòng thơm được chọn từ nhóm bao gồm H1, H2, H15 hoặc H20,



R^5 là triflometyl,

R^6 là hydro,

R^7 là metyl,

n bằng 2.

4. Sản phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông chứa chúng để kiểm soát một hoặc nhiều loài động vật gây hại.

5. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 3, trong đó:

R^2 -V là Q-51,

V là V-95 và được thế một lần bằng clo, và

X là H20.

6. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó:

A^1 là nito,

R^2 -V là Q51, được thế tùy ý bằng cyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy,

V là V-95, được thế tùy ý bằng cyano, halogen, (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) haloalkyl, (C_1-C_4) alkoxy hoặc (C_1-C_4) haloalkoxy, và

X là H20.

7. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 6, trong đó V được thế một lần bằng clo.
8. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó A^1 là nito.
9. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó A^1 là $=N^+(O^-)$.
10. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó A^1 là $=C(R^4)$.
11. Chế phẩm hóa nông chứa một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và cũng chứa một hoặc nhiều chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt.
12. Chế phẩm hóa nông theo điểm 11, trong đó chế phẩm này còn chứa thêm hoạt chất hóa nông khác.
13. Phương pháp kiểm soát một hoặc nhiều sinh vật gây hại, bao gồm bước cho hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông chứa chúng tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng.