



(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)



1-0032027

(51)⁷ A01N 43/00; C07D 513/04; C07D
487/04; C07D 498/04; A01N 43/90;
C07D 471/04

(13) B

(21) 1-2015-03789

(22) 11/04/2014

(86) PCT/EP2014/057344 11/04/2014

(87) WO/2014/167084 16/10/2014

(30) 61/810,746 11/04/2013 US

(45) 25/05/2022 410

(43) 25/03/2016 336A

(73) BASF SE (DE)

67056 Ludwigshafen, Germany

(72) Narine, Arun (CA); BANDUR, Nina Gertrud (DE); DICKHAUT, Joachim (DE);
DERKSEN, Swetlana (DE); KOLLER, Raffael (CH); VON DEYN, Wolfgang (DE);
WACH, Jean-Yves (FR); CULBERTSON, Deborah L. (US).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT PYRIMIDINI ĐƯỢC THỂ, CHẾ PHẨM DÙNG TRONG NÔNG
NGHIỆP VÀ HẠT GIỐNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY, PHƯƠNG PHÁP BẢO VỆ
THỰC VẬT VÀ VẬT LIỆU NHÂN GIỐNG THỰC VẬT VÀ PHƯƠNG PHÁP
CHỐNG LẠI SỰ XÂM NHIỄM HOẶC LÂY NHIỄM BỞI LOÀI GÂY HẠI
KHÔNG XƯƠNG SỐNG

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất pyrimidini được thể có tác dụng chống lại côn trùng
và/hoặc chế phẩm và hạt giống chứa hợp chất này. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp
bảo vệ thực vật và vật liệu nhân giống thực vật, và phương pháp chống lại loài gây hại
không xương sống. Sáng chế cũng đề cập đến chất đồng phân lập thể, muối, tautome và N-
oxit của chúng cũng như chế phẩm chứa chúng.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất pyrimidini được thể có tác dụng diệt côn trùng và/hoặc chế phẩm chứa hợp chất này để chống lại loài gây hại không xương sống. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp diệt loài gây hại, bộc lộ việc sử dụng và ứng dụng của hợp chất pyrimidini được thể như được nêu trong bản mô tả này và chất đồng phân lập thể, muối, tautome và N-oxit của chúng cũng như chế phẩm chứa chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

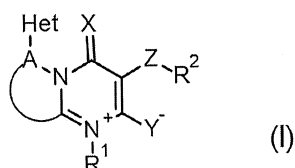
Các loài gây hại không xương sống và cụ thể là côn trùng, động vật chân đốt và giun tròn phá hoại thực vật đang phát triển và đã được thu hoạch và tấn công các công trình nhà ở và các công trình thương mại bằng gỗ, từ đó gây tổn thất lớn về kinh tế đối với ngành cung cấp thực phẩm và đối với tài sản. Mặc dù đã biết một lượng lớn các chất diệt loài gây hại, nhưng do khả năng phát triển tính kháng của các loài gây hại đích đối với các chất đã nêu, nên vẫn cần phải có các chất mới để diệt các loài gây hại không xương sống như côn trùng, động vật thuộc lớp nhện và giun tròn.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất có hoạt tính cao diệt loài gây hại và thể hiện phổ hoạt tính rộng đối với một số lượng lớn các loài gây hại không xương sống khác nhau, đặc biệt là đối với côn trùng, động vật thuộc lớp nhện và giun tròn khó phòng trừ.

Đã phát hiện ra rằng các mục đích này có thể đạt được bằng hợp chất pyrimidini được thể có công thức chung (I), như được xác định dưới đây, bao gồm chất đồng phân lập thể của chúng, muối của chúng, cụ thể là muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y của chúng, tautome của chúng và N-oxit của chúng.

Do đó, theo khía cạnh thứ nhất, sáng chế đề xuất hợp chất pyrimidini được thể có công thức (I) hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất pyrimidini được thể có công thức (I)



trong đó:

mỗi X, Y độc lập là O hoặc S;

Z là liên kết trực tiếp, O, S(O)_m, NR^b, C(R^aR^{aa})O, C(=X¹), C(=X¹)Y¹, hoặc Y¹C(=X¹);

X¹ là O, S, hoặc NR^b;

Y¹ là O, S, hoặc NR^c;

A là CH hoặc N và, trong đó nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng có bốn đến bảy cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 O, tối đa 2 S, và tối đa 3 N(R^c)_p, trong đó tối đa 2 thành phần vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và thành phần vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)_m, trong đó mỗi vòng có thể được thể bằng tối đa 3 R^a;

Het là vòng dị vòng có ba đến mười cạnh hoặc hệ vòng dị vòng có bảy đến mười một cạnh, mỗi thành phần vòng hoặc hệ vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và lên đến 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 O, tối đa 2 S, và lên đến 4 N(R^c)_p, trong đó tối đa 3 thành phần vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và thành phần vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)_o(=NR^b)_q, mỗi vòng hoặc hệ vòng được thể tùy ý bằng lên đến 5 R^a;

mỗi o, q độc lập là 0, 1 hoặc 2, với điều kiện là tổng (o + q) là 0, 1 hoặc 2 đối với

mỗi vòng;

R^1 là hydro, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_3 - C_{10} -xycloalkyl, C_4 - C_{10} -xycloalkenyl, C_5 - C_{14} -xycloalkylxycloalkyl hoặc R^1 có thể tạo thành vòng hoặc hệ vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến mười một cạnh, có thể chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, và trong đó các nhóm nêu trên và hệ vòng cacbon hoặc dị vòng có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^a ; hoặc

R^1 là $C(=O)R^b$, $C(=O)OR^c$, NR^bR^c , $C(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $SO_2NR^bR^c$, $OC(=O)R^c$, $OC(=O)OR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $N(R^c)C(=O)R^c$, $N(R^c)C(=O)OR^c$, $N(R^c)C(=O)NR^bR^c$, $NR^cSO_2R^b$, $NR^cSO_2NR^bR^c$, $Si(R^d)_3$, $C(=NR^c)R^c$, $C(=NOR^c)R^c$, $C(=NNR^bR^c)R^c$, $C(=NN(C(=O)R^b)R^c)R^c$, $C(=NN(C(=O)OR^c)(R^c)_2)R^c$, $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, hoặc $N=CR^bR^c$;

mỗi R^a độc lập là halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , $C(=O)(O)_pR^c$, $OC(=O)(O)_pR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $NR^bC(=O)(O)_pR^c$, $NR^bC(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $S(O)_mR^b$, $SO_2NR^bR^c$, OSO_2R^c , $OSO_2NR^bR^c$, $NR^bSO_2R^c$, $NR^bSO_2NR^bR^c$, $N=S(=O)_pR^cR^c$, $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^d)_3$ hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ $N-(R^c)_p$, O, và S mà có thể được oxy hóa, và trong đó các nhóm nêu trên và vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} , hoặc

hai nhóm R^a được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

mỗi R^{aa} độc lập là halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy;

mỗi R^b độc lập là hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại

được chọn từ $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa và vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

mỗi R^c độc lập là hydro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkylcarbonyl, C₁-C₆-xycloalkyl, hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^{aa})_p$, O và S, trong đó S có thể được oxy hóa và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

trong đó hai nhóm R^bR^b , R^cR^b hoặc R^cR^c cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào có thể tạo thành vòng cacbon hoặc dị vòng no, không no một phần hoặc thơm có 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh, có thể chứa 1 đến 2 nguyên tử khác loại hoặc nhóm nguyên tử khác loại được chọn từ N, O, S, NO, SO và SO₂ và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^3 ;

mỗi R^d độc lập là hydro, phenyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-xycloalkyl, hoặc C₁-C₆-alkoxyalkyl, trong đó các nhóm được đề cập ở trên có thể được thế bằng một hoặc nhiều halogen;

mỗi R^e độc lập là C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkylcarbonyl, C₁-C₆-xycloalkyl, hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^{aa})_p$, O và S, trong đó S có thể được oxy hóa và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

n là 0, 1 hoặc 2;

m là 0, 1, hoặc 2;

p là 0 hoặc 1;

R^2 là H, halogen, CN, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₃-C₁₀-xycloalkyl, C₄-C₁₀-alkylxycloalkyl, C₄-C₁₀-xycloalkylalkyl, C₆-C₁₄-

xycloalkylxycloalkyl, C₅-C₁₀-alkylxycloalkylalkyl, hoặc C₃-C₆-xycloalkenyl, trong đó các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a}, hoặc R² có thể tạo thành vòng cacbon hoặc dị vòng có ba đến mười cạnh hoặc hệ vòng có bảy đến mười một cạnh, vòng hoặc hệ vòng này có thể no, không no một phần, hoặc thơm, và vòng hoặc hệ vòng có thể chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ N(R^c)_p, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng hoặc hệ vòng có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a};

với điều kiện là nếu R² là halogen hoặc CN, thì Z là liên kết trực tiếp;

mỗi R^{2a} độc lập là halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, CN, OR^c, NR^bR^c, NO₂, C(=O)(O)_pR^c, OC(=O)(O)_pR^c, C(=O)NR^bR^c, OC(=O)NR^bR^c, NR^bC(=O)(O)_pR^c, NR^bC(=O)NR^bR^c, C(=S)NR^bR^c, S(O)_mR^b, SO₂NR^bR^c, OSO₂R^c, OSO₂NR^bR^c, NR^bSO₂R^c, NR^bSO₂NR^bR^c, SF₅, OCN, SCN, Si(R^d)₃, C(=N(O)_pR^b)R^b, C(=NNR^bR^c)R^b, C(=NN(C(=O)O_pR^c)R^c)R^b, ON=CR^bR^c, ONR^bR^c, S(=O)_o(=NR^b)_qR^c, SO₂NR^b(=O)NR^bR^c, P(=X²)R^bR^c, OP(=X²)(O_pR^c)R^b, OP(=X²)(OR^c)₂, N=CR^bR^c, NR^bN=CR^bR^c, NR^bNR^bR^c, NR^bC(=S)NR^bR^c, NR^bC(=NR^b)NR^bR^c, NR^bNR^bC(=X²)NR^bR^c, NR^bNR^bSO₂NR^bR^c, N=S(=O)_pR^cR^c, hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ N-(R^c)_p, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, và trong đó các nhóm nêu trên và vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2aa}, hoặc

hai nhóm R^{2a} được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ =O, =S, =CR^bR^c, =NR^c, =NOR^c, và =NNR^cR^c;

mỗi R^{2aa} độc lập là halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, CN, OR^c, NR^bR^c, NO₂, C(=O)(O)_pR^c, OC(=O)(O)_pR^c, C(=O)NR^bR^c, OC(=O)NR^bR^c, NR^bC(=O)(O)_pR^c,

$\text{NR}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^b$, $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, OSO_2R^c ,
 $\text{OSO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{SO}_2\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, SF_5 , OCN , SCN , $\text{Si}(\text{R}^d)_3$,
 $\text{C}(=\text{N}(\text{O})_p\text{R}^b)\text{R}^b$, $\text{C}(=\text{NNR}^b\text{R}^c)\text{R}^b$, $\text{C}(=\text{NN}(\text{C}(=\text{O})\text{O}_p\text{R}^c)\text{R}^b)\text{R}^b$,
 $\text{ON}=\text{CR}^b\text{R}^c$, ONR^bR^c , $\text{S}(=\text{O})_o(=\text{NR}^b)_q\text{R}^c$, $\text{SO}_2\text{NR}^b(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$,
 $\text{P}(=\text{X}^2)\text{R}^b\text{R}^c$, $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{O}_p\text{R}^c)\text{R}^b$, $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{OR}^c)_2$, $\text{N}=\text{CR}^b\text{R}^c$,
 $\text{NR}^b\text{N}=\text{CR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{C}(=\text{S})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{C}(=\text{NR}^b)\text{NR}^b\text{R}^c$,
 $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{C}(=\text{X}^2)\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, hoặc $\text{N}=\text{S}(=\text{O})_p\text{R}^c\text{R}^c$,
 hoặc

hai nhóm R^{2aa} được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ $=\text{O}$, $=\text{S}$, $=\text{CR}^b\text{R}^c$, $=\text{NR}^c$, $=\text{NOR}^c$, và $=\text{NNR}^c\text{R}^c$;

X^2 độc lập là O hoặc S;

mỗi R^3 độc lập là halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkoxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-alkynyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkyl}$, CN , OR^c ,
 NR^bR^c , NO_2 , $\text{C}(=\text{O})(\text{O})_p\text{R}^c$, $\text{OC}(=\text{O})(\text{O})_p\text{R}^c$, $\text{C}(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$,
 $\text{NR}^b\text{C}(=\text{O})(\text{O})_p\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{C}(=\text{S})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^b$, $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$,
 OSO_2R^c , $\text{OSO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{SO}_2\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, SF_5 , OCN , SCN ,
 $\text{Si}(\text{R}^d)_3$, $\text{C}(=\text{N}(\text{O})_p\text{R}^b)\text{R}^b$, $\text{C}(=\text{NNR}^b\text{R}^c)\text{R}^b$, $\text{C}(=\text{NN}(\text{C}(=\text{O})\text{O}_p\text{R}^c)\text{R}^b)\text{R}^b$,
 $\text{ON}=\text{CR}^b\text{R}^c$, ONR^bR^c , $\text{S}(=\text{O})_o(=\text{NR}^b)_q\text{R}^c$, $\text{SO}_2\text{NR}^b(=\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$,
 $\text{P}(=\text{X}^2)\text{R}^b\text{R}^c$, $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{O}_p\text{R}^c)\text{R}^b$, $\text{OP}(=\text{X}^2)(\text{OR}^c)_2$, $\text{N}=\text{CR}^b\text{R}^c$,
 $\text{NR}^b\text{N}=\text{CR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{C}(=\text{S})\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{C}(=\text{NR}^b)\text{NR}^b\text{R}^c$,
 $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{C}(=\text{X}^2)\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{NR}^b\text{NR}^b\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, hoặc $\text{N}=\text{S}(=\text{O})_p\text{R}^c\text{R}^c$, hoặc

hai nhóm R^3 được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ $=\text{O}$, $=\text{S}$, $=\text{CR}^b\text{R}^c$, $=\text{NR}^c$, $=\text{NOR}^c$, và $=\text{NNR}^c\text{R}^c$;

và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng.

Hợp chất pyrimidini được thể có công thức (I), và muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp của chúng có hoạt tính chống lại động vật gây hại cao, ví dụ động vật chân khớp và giun tròn gây hại, đặc biệt là chống lại côn trùng và động vật thuộc họ Acaridae khó phòng trừ.

Ngoài ra, sáng chế đề xuất và bao gồm các phương án sau đây:

- các chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên;
- các chế phẩm dùng trong nông nghiệp và trong thú y chứa lượng của ít nhất một hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang hoặc muối của chúng như được xác định ở trên;
- phương pháp chống lại loài gây hại không xương sống, sự xâm nhiễm, hoặc sự lây nhiễm bởi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm bước cho các loài gây hại này hoặc nguồn cung cấp thức ăn, môi trường sống hoặc nơi sinh sản của nó tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm của chúng;
- phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống, sự xâm nhiễm, hoặc sự lây nhiễm bởi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho các loài gây hại này hoặc nguồn cung cấp thức ăn, môi trường sống hoặc nơi sinh sản của nó tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I);
- phương pháp ngăn ngừa hoặc bảo vệ chống lại loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho các loài gây hại không xương sống, hoặc nguồn cung cấp thức ăn của chúng, môi trường sống hoặc nơi sinh sản của nó tiếp xúc với hợp chất pyrimidini được thể có công thức chung (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I);
- phương pháp bảo vệ cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và/hoặc thực vật đang sinh trưởng khỏi sự tấn công hoặc sự xâm nhiễm bởi loài gây hại không xương sống bao gồm bước xử lý hoặc cho cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và thực vật đang sinh trưởng, hoặc đất trồng, vật liệu, bề mặt, khoảng không, diện tích hoặc nước trong đó cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật này được lưu giữ hoặc thực vật đang sinh trưởng, tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I);
- phương pháp không phải là phương pháp điều trị bệnh để xử lý động vật bị xâm

nhiễm hoặc bị lây nhiễm bởi vật ký sinh hoặc ngăn ngừa động vật không bị lây nhiễm bởi vật ký sinh hoặc bị lây nhiễm bởi vật ký sinh hoặc bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi vật ký sinh bao gồm việc dùng hoặc cấp qua đường miệng, tại chỗ hoặc ngoài đường tiêu hóa cho động vật lượng có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I);

- phương pháp xử lý, phòng trừ, ngăn ngừa hoặc bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi vật ký sinh bằng cách dùng hoặc cấp qua đường miệng, tại chỗ hoặc ngoài đường tiêu hóa cho động vật hợp chất pyrimidini được thể có công thức chung (I) như được xác định ở trên hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I);
- hạt giống chứa hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên, với lượng nằm trong khoảng từ 0,1 g đến 10 kg tính theo mỗi 100 kg hạt giống;
- sử dụng hợp chất có công thức (I) như được xác định ở trên để bảo vệ thực vật đang sinh trưởng hoặc vật liệu nhân giống thực vật khỏi sự tấn công hoặc sự xâm nhiễm bởi loài gây hại không xương sống;
- sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng để chống lại vật ký sinh trong và trên động vật;
- quy trình điều chế chế phẩm dùng trong thú y để xử lý, phòng trừ, ngăn ngừa hoặc bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi vật ký sinh bao gồm việc bổ sung lượng có tác dụng chống lại vật ký sinh của hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang và/ hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng vào chế phẩm chất mang thích hợp để sử dụng trong thú y;
- sử dụng hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang và/ hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng để bào chế thuốc dùng để xử lý, phòng trừ, ngăn ngừa hoặc bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi vật ký sinh.

Mô tả chi tiết sáng chế

Tất cả hợp chất theo sáng chế bao gồm, cả nếu có thể áp dụng, các chất đồng phân lập thể của chúng, các tautome của chúng, các muối của chúng hoặc các N-oxit của chúng cũng như các chế phẩm của chúng, đặc biệt hữu dụng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống, cụ thể là để phòng trừ động vật chân đốt và giun tròn và đặc biệt là côn trùng. Do đó, sáng chế đề cập đến việc sử dụng hợp chất như được bộc lộ trong sáng chế này, để chống lại hoặc phòng trừ các loài gây hại không xương sống, cụ thể là các loài gây hại không xương sống thuộc nhóm côn trùng, động vật thuộc lớp nhện hoặc giun tròn.

Thuật ngữ "(các) hợp chất theo sáng chế" hoặc "(các) hợp chất có công thức (I)" như được sử dụng trong sáng chế này được dùng để chỉ và bao gồm (các) hợp chất như được xác định trong bản mô tả này và/hoặc (các) chất đồng phân lập thể, (các) muối, (các) tautome hoặc (các) N-oxit của chúng. Thuật ngữ "(các) hợp chất của sáng chế" phải được hiểu là tương đương với thuật ngữ "(các) hợp chất theo sáng chế", do đó cũng chứa (các) chất đồng phân lập thể, (các) muối, (các) tautome hoặc (các) N-oxit của hợp chất có công thức (I).

Thuật ngữ "(các) chế phẩm theo sáng chế" hoặc "(các) chế phẩm của sáng chế" bao gồm (các) chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) theo sáng chế như được xác định ở trên, do đó cũng bao gồm chất đồng phân lập thể, muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y, tautome hoặc N-oxit của hợp chất có công thức (I).

Hợp chất pyrimidini được thể có công thức (I) theo sáng chế chưa được mô tả để dùng chống lại loài gây hại hoặc ứng dụng chống lại loài gây hại trong ngành công nghiệp nông nghiệp hoặc công nghệ thú y.

Dẫn xuất pyridini được thể dị vòng và ứng dụng của chúng làm thuốc chống lại loài gây hại được bộc lộ trong WO 2009/099929 cũng như trong WO 2011/017347 và trong WO 2011/017351.

Tuy nhiên, hợp chất pyrimidini được thể cụ thể là có công thức (I) với kiểu thể đặc trưng như được xác định trong sáng chế chưa được mô tả.

Phụ thuộc vào kiểu thể, hợp chất có công thức (I) có thể có một hoặc nhiều tâm

không đối xứng, trong đó chúng thể hiện dưới dạng hỗn hợp của các chất đồng phân đối ảnh hoặc chất đồng phân không đối quang. Sáng chế đề xuất cả các chất đồng phân đối ảnh tinh khiết hoặc chất đồng phân không đối quang tinh khiết đơn của hợp chất có công thức (I), và hỗn hợp của chúng và ứng dụng theo sáng chế của các chất đồng phân đối ảnh tinh khiết hoặc chất đồng phân không đối quang tinh khiết của hợp chất có công thức (I) hoặc hỗn hợp của nó. Hợp chất thích hợp có công thức (I) cũng bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình lập thể (chất đồng phân cis/trans) và hỗn hợp của chúng. Chất đồng phân cis/trans có thể thể hiện đối với alken, liên kết đôi cacbon-nitơ hoặc nhóm amit. Thuật ngữ "(các) chất đồng phân lập thể" bao gồm cả chất đồng phân quang học, như các chất đồng phân đối ảnh hoặc chất đồng phân không đối quang, hạt giống nhiều hơn một tâm không đối xứng trong phân tử, cũng như chất đồng phân dị hình (chất đồng phân cis/trans). Sáng chế đề cập đến tất cả các chất đồng phân lập thể có thể của các hợp chất có công thức (I), chẳng hạn các chất đồng phân đối ảnh hoặc các chất đồng phân không đối quang, cũng như các hỗn hợp của chúng.

Phụ thuộc vào kiểu thể, hợp chất có công thức (I) có thể thể hiện dưới dạng các tautome của chúng. Do đó sáng chế cũng đề cập đến các tautome có công thức (I) và chất đồng phân lập thể, muối, tautome và N-oxit của tautome nêu trên.

Hợp chất theo sáng chế có thể là dạng vô định hình hoặc có thể tồn tại ở một hoặc nhiều dạng tinh thể khác nhau (các dạng đa hình) hoặc các biến thể mà có thể có các đặc tính vĩ mô khác nhau như độ ổn định, hoặc thể hiện các tính chất sinh học khác nhau như hoạt tính. Sáng chế bao gồm cả các hợp chất dạng vô định hình và dạng tinh thể có công thức (I), các hỗn hợp của các trạng thái tinh thể khác nhau hoặc các biến thể của hợp chất tương ứng (I), cũng như các muối dạng vô định hình và dạng tinh thể của nó.

Muối của hợp chất có công thức (I) tốt hơn là muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp và/hoặc thú y. Chúng có thể được tạo ra theo phương pháp thông thường, ví dụ bằng cách cho hợp chất phản ứng với axit của anion vẫn đang được thảo luận nếu hợp chất có công thức (I) có độ hoạt động bazơ hoặc bằng cách cho hợp chất có tính axit có công thức (I) phản ứng với bazơ thích hợp.

Muối hữu dụng trong nông nghiệp hoặc trong thú y thích hợp đặc biệt là muối của các cation hoặc muối bổ sung axit của axit mà các cation và anion của chúng, tương

ứng, không có tác dụng có hại bất kỳ với tác dụng của hợp chất theo sáng chế. Các cation thích hợp cụ thể là các ion của kim loại kiềm, tốt hơn là lithi, natri và kali, của kim loại đất kiềm, tốt hơn là canxi, magie và bari, và của kim loại chuyển hóa, tốt hơn là mangan, đồng, kẽm và sắt, và cũng amoni (NH_4^+) và amoni được thế trong đó một đến bốn nguyên tử hydro được thế bằng $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-hydroxyalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{hydroxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, phenyl hoặc benzyl. Các ví dụ về các ion amoni được thế bao gồm metylamoni, isopropylamoni, dimethylamoni, diisopropylamoni, trimethylamoni, tetramethylamoni, tetraethylamoni, tetrabutylamoni, 2-hydroxyethylamoni, 2-(2-hydroxyetoxy)etyl-amoni, bis(2-hydroxyetyl)amoni, benzyltrimethylamoni và benzyltriethylamoni, ngoài ra, các ion phosphoni, các ion sulfoni, tốt hơn là tri($\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$)sulfoni, và các ion sulfoxoni, tốt hơn là tri($\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$)sulfoxoni.

Các anion của các muối cộng axit hữu ích ban đầu là clorua, bromua, florua, hydro sulfat, sulfat, dihydro phosphat, hydro phosphat, phosphat, nitrat, hydro carbonat, carbonat, hexaflosilicat, hexaflophosphat, benzoat, và các anion của axit $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkanoic}$, tốt hơn là format, axetat, propionat và butyrat. Chúng có thể được tạo thành bằng cách cho các hợp chất có công thức I phản ứng với axit của anion tương ứng, tốt hơn là của axit clohydric, axit bromhydric, axit sulfuric, axit phosphoric hoặc axit nitric.

Thuật ngữ "N-oxit" bao gồm hợp chất bất kỳ theo sáng chế có ít nhất một nguyên tử nitơ bậc ba được oxy hóa với gốc N-oxit.

Các gốc hữu cơ được đề cập trong các định nghĩa ở trên của các biến thể là – giống như thuật ngữ halogen - các thuật ngữ chung đối với các danh mục riêng của các thành phần nhóm riêng. Tiền tố $\text{C}_n\text{-C}_m$ chỉ ra trong mỗi trường hợp số có thể có của các nguyên tử cacbon trong nhóm này.

"Halogen" có nghĩa là flo, clo, brom và iot.

Thuật ngữ "được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn" có nghĩa là 1 hoặc nhiều, chẳng hạn 1, 2, 3, 4 hoặc 5 hoặc tất cả trong số các nguyên tử hydro của gốc đã nêu được thay thế bằng nguyên tử halogen, cụ thể là flo hoặc clo.

Thuật ngữ " $\text{C}_n\text{-C}_m\text{-alkyl}$ " như được sử dụng trong bản mô tả (và cũng trong $\text{C}_n\text{-C}_m\text{-alkylamino}$, $\text{di-C}_n\text{-C}_m\text{-alkylamino}$, $\text{C}_n\text{-C}_m\text{-alkylaminocarbonyl}$, $\text{di-(C}_n\text{-C}_m\text{-$

alkylamino)carbonyl, C_n - C_m -alkylthio, C_n - C_m -alkylsulfinyl và C_n - C_m -alkylsulfonyl) đề cập đến nhóm hydrocacbon no, mạch nhánh hoặc không mạch nhánh có từ n đến m , ví dụ 1 đến 10 nguyên tử cacbon, tốt hơn là 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ metyl, etyl, propyl, 1-metyletyl, butyl, 1-metylpropyl, 2-metylpropyl, 1,1- dimetyletyl, pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, hexyl, 1,1-dimetylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, 1-metylpentyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 4-metylpentyl, 1,1-dimetylbutyl, 1,2-dimetylbutyl, 1,3-dimetylbutyl, 2,2-dimetylbutyl, 2,3-dimetylbutyl, 3,3-dimetylbutyl, 1-etylbutyl, 2-etylbutyl, 1,1,2-trimetylpropyl, 1,2,2-trimetylpropyl, 1-etyl-1-metylpropyl, 1-etyl-2-metylpropyl, heptyl, octyl, 2-etylhexyl, nonyl và dexyl và chất đồng phân của chúng. C_1 - C_4 -alkyl có nghĩa là ví dụ metyl, etyl, propyl, 1-metyletyl, butyl, 1-metylpropyl, 2-metylpropyl hoặc 1,1-dimetyletyl.

Thuật ngữ " C_n - C_m -haloalkyl" như được sử dụng trong bản mô tả (và cũng trong C_n - C_m -haloalkylsulfinyl và C_n - C_m -haloalkylsulfonyl) dùng để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ n đến m các nguyên tử cacbon, ví dụ 1 đến 10 cụ thể là 1 đến 6 nguyên tử cacbon (như được đề cập ở trên), trong đó một số hoặc tất cả nguyên tử hydro trong các nhóm này có thể được thay thế bằng các nguyên tử halogen như được đề cập ở trên, ví dụ C_1 - C_4 -haloalkyl, chẳng hạn như clometyl, bromometyl, diclometyl, triclometyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, cloflometyl, dicloflometyl, clodiflometyl, 1-cloetyl, 1-bromoetyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, 2-clo-2-floetyl, 2-clo-2,2-difloetyl, 2,2-diclo-2-floetyl, 2,2,2-tricloetyl, pentaflloetyl và các nhóm tương tự. Thuật ngữ C_1 - C_{10} -haloalkyl cụ thể bao gồm C_1 - C_2 -floalkyl, mà đồng nghĩa với metyl hoặc etyl, trong đó 1, 2, 3, 4 hoặc 5 nguyên tử hydro được thế bằng nguyên tử flo, chẳng hạn như flometyl, diflometyl, triflometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl và pentaflometyl.

Tương tự, " C_n - C_m -alkoxy" và " C_n - C_m -alkylthio" (hoặc C_n - C_m -alkylsulfenyl, một cách tương ứng) dùng để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ n đến m các nguyên tử cacbon, ví dụ 1 đến 10, cụ thể là 1 đến 6 hoặc 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được đề cập ở trên) được liên kết thông qua liên kết oxy (hoặc lưu huỳnh, lần lượt) ở liên kết bất kỳ trong nhóm alkyl. Các ví dụ bao gồm C_1 - C_4 -alkoxy chẳng hạn như metoxy, etoxy, propoxy, isopropoxy, butoxy, sec-butoxy, isobutoxy và tert-butoxy, ngoài ra C_1 - C_4 -alkylthio chẳng hạn như metylthio, etylthio, propylthio, isopropylthio,

và n-butylthio.

Do vậy, các thuật ngữ " C_n - C_m -haloalkoxy" và " C_n - C_m -haloalkylthio" (hoặc C_n - C_m -haloalkylsulfenyl, một cách tương ứng) dùng để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ n đến m nguyên tử cacbon, ví dụ 1 đến 10, cụ thể là 1 đến 6 hoặc 1 đến 4 nguyên tử cacbon (như được đề cập ở trên) được liên kết thông qua liên kết oxy hoặc lưu huỳnh, lần lượt, ở liên kết bất kỳ trong nhóm alkyl, trong đó một số hoặc tất cả nguyên tử hydro trong các nhóm này có thể được thay thế bằng các nguyên tử halogen như được đề cập ở trên, ví dụ C_1 - C_2 -haloalkoxy, chẳng hạn như clometoxy, bromometoxy, diclometoxy, triclometoxy, flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, cloflometoxy, dicloflometoxy, clodiflometoxy, 1-cloetoxy, 1-bromoetoxy, 1-floetoxy, 2-floetoxy, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2-clo-2-floetoxy, 2-clo-2,2-difloetoxy, 2,2-diclo-2-floetoxy, 2,2,2-tricloetoxy và pentaflometoxy, ngoài ra C_1 - C_2 -haloalkylthio, chẳng hạn như clometylthio, bromometylthio, diclometylthio, triclometylthio, flometylthio, diflometylthio, triflometylthio, cloflometylthio, dicloflometylthio, clodiflometylthio, 1-cloetylthio, 1-bromoetylthio, 1-floetylthio, 2-floetylthio, 2,2-difloetylthio, 2,2,2-trifloetylthio, 2-clo-2-floetylthio, 2-clo-2,2-difloetylthio, 2,2-diclo-2-floetylthio, 2,2,2-tricloetylthio và pentaflometylthio và các nhóm tương tự. Tương tự các thuật ngữ C_1 - C_2 -floalkoxy và C_1 - C_2 -floalkylthio dùng để chỉ C_1 - C_2 -floalkyl mà được liên kết vào phần còn lại của phân tử thông qua nguyên tử oxy hoặc nguyên tử lưu huỳnh, một cách tương ứng.

Thuật ngữ " C_2 - C_m -alkenyl" như được sử dụng trong bản mô tả nhằm vào nhóm hydrocacbon chưa no mạch nhánh hoặc không phải mạch nhánh có từ 2 đến m, chẳng hạn từ 2 đến 10 hoặc từ 2 đến 6 nguyên tử cacbon và được gắn vào cùng một nguyên tử ở vị trí bất kỳ, chẳng hạn như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-metyl-etenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-metyl-1-propenyl, 2-metyl-1-propenyl, 1-metyl-2-propenyl, 2-metyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-metyl-1-butenyl, 2-metyl-1-butenyl, 3-metyl-1-butenyl, 1-metyl-2-butenyl, 2-metyl-2-butenyl, 3-metyl-2-butenyl, 1-metyl-3-butenyl, 2-metyl-3-butenyl, 3-metyl-3-butenyl, 1,1-dimetyl-2-propenyl, 1,2-dimetyl-1-propenyl, 1,2-dimetyl-2-propenyl, 1-etyl-1-propenyl, 1-etyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-metyl-1-pentenyl, 2-metyl-1-pentenyl, 3-metyl-1-pentenyl, 4-metyl-1-pentenyl, 1-metyl-2-pentenyl, 2-

metyl-2-pentenyl, 3-metyl-2-pentenyl, 4-metyl-2-pentenyl, 1-metyl-3-pentenyl, 2-metyl-3-pentenyl, 3-metyl-3-pentenyl, 4-metyl-3-pentenyl, 1-metyl-4-pentenyl, 2-metyl-4-pentenyl, 3-metyl-4-pentenyl, 4-metyl-4-pentenyl, 1,1-dimetyl-2-butenyl, 1,1-dimetyl-3-butenyl, 1,2-dimetyl-1-butenyl, 1,2-dimetyl-2-butenyl, 1,2-dimetyl-3-butenyl, 1,3-dimetyl-1-butenyl, 1,3-dimetyl-2-butenyl, 1,3-dimetyl-3-butenyl, 2,2-dimetyl-3-butenyl, 2,3-dimetyl-1-butenyl, 2,3-dimetyl-2-butenyl, 2,3-dimetyl-3-butenyl, 3,3-dimetyl-1-butenyl, 3,3-dimetyl-2-butenyl, 1-etyl-1-butenyl, 1-etyl-2-butenyl, 1-etyl-3-butenyl, 2-etyl-1-butenyl, 2-etyl-2-butenyl, 2-etyl-3-butenyl, 1,1,2-trimetyl-2-propenyl, 1-etyl-1-metyl-2-propenyl, 1-etyl-2-metyl-1-propenyl và 1-etyl-2-metyl-2-propenyl.

Thuật ngữ " C_2-C_m -alkynyl" như được sử dụng trong bản mô tả dùng để chỉ nhóm hydrocacbon chưa no mạch nhánh hoặc không phải mạch nhánh có từ 2 đến m, chẳng hạn từ 2 đến 10 hoặc từ 2 đến 6 các nguyên tử cacbon và chứa ít nhất một liên kết ba, chẳng hạn như etynyl, propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ " C_n-C_m -alkoxy- C_n-C_m -alkyl" như được sử dụng trong bản mô tả dùng để chỉ alkyl có n đến m nguyên tử cacbon, chẳng hạn giống như các ví dụ cụ thể được đề cập ở trên, trong đó một nguyên tử hydro của gốc alkyl được thay thế bằng nhóm C_n-C_m -alkoxy; trong đó giá trị n và m của nhóm alkoxy độc lập được chọn từ giá trị n và m của nhóm alkyl.

Hậu tố "-cacbonyl" trong nhóm hoặc " $C(=O)$ " dùng để chỉ ở từng trường hợp là nhóm được liên kết với phần còn lại của phân tử qua nhóm cacbonyl $C=O$. Đây là trường hợp ví dụ trong alkylcacbonyl, haloalkylcacbonyl, aminocacbonyl, alkylaminocacbonyl, dialkylaminocacbonyl, alkoxycacbonyl, haloalkoxycacbonyl.

Thuật ngữ "aryl" như được sử dụng trong bản mô tả này dùng để chỉ gốc hydrocacbon thơm một, hai hoặc b vòng như phenyl hoặc naphtyl, cụ thể là phenyl (cũng dùng để chỉ C_6H_5 giống như là chất thay thế).

Thuật ngữ "hệ vòng" dùng để chỉ hai hoặc nhiều vòng liên kết trực tiếp.

Thuật ngữ " C_3-C_m -xycloalkyl" như trong bản mô tả này được dùng để chỉ vòng đơn của gốc xyclobéo no có 3 đến m cạnh, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl, xyclooctyl và xyclodecyl.

Thuật ngữ "alkylxycloalkyl" dùng để chỉ giống như thuật ngữ "alkyl được thế bằng xycloalkyl" nhóm alkyl được thế bằng vòng xycloalkyl, trong đó alkyl và xycloalkyl là như được xác định trong bản mô tả này.

Thuật ngữ "xycloalkylalkyl" dùng để chỉ giống như thuật ngữ "xycloalkyl được thế bằng alkyl" vòng xycloalkyl được thế bằng nhóm alkyl, trong đó alkyl và xycloalkyl là như được xác định trong bản mô tả này.

Thuật ngữ "alkylxycloalkylalkyl" dùng để chỉ giống như thuật ngữ "alkylxycloalkyl có thể được thế bằng alkyl" nhóm alkylxycloalkyl được thế bằng alkyl, trong đó alkyl và alkylxycloalkyl là như được xác định trong bản mô tả này.

Thuật ngữ " C_3 - C_m -xycloalkenyl" như trong bản mô tả này được dùng để chỉ vòng đơn của gốc xyclobéo không no một phần có 3 đến m cạnh.

Thuật ngữ "xycloalkylxycloalkyl" dùng để chỉ giống như thuật ngữ "xycloalkyl có thể được thế bằng xycloalkyl" sự thay thế xycloalkyl trên vòng xycloalkyl khác, trong đó mỗi vòng xycloalkyl độc lập là có từ 3 đến 7 thành phần vòng chứa nguyên tử cacbon và các xycloalkyl liên kết thông qua một liên kết đơn hoặc có một nguyên tử cacbon chung. Các ví dụ về xycloalkylxycloalkyl bao gồm xyclopropylxyclopropyl (ví dụ 1,1'-bixyclopropyl-2-yl), xyclohexylxyclohexyl trong đó hai vòng liên kết thông qua một nguyên tử cacbon chung đơn (ví dụ 1,1'-bixyclohexyl-2-yl), xyclohexylxyclopentyl trong đó hai vòng liên kết thông qua một liên kết đơn (ví dụ 4-xyclopentylxyclohexyl) và chất đồng phân lập thể khác nhau của chúng như (1R,2S)-1, 1'-bixyclopropyl-2-yl và (1R,2R)-1,1'-bixyclopropyl-2-yl.

Thuật ngữ "vòng cacbovòng 3 đến 6 cạnh" như được dùng trong bản mô tả này được dùng để chỉ các vòng xyclopropan, xyclobutan, xyclopentan và xyclohexan.

Thuật ngữ "vòng dị vòng no, không no một phần hoặc thơm 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh có thể chứa 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại" hoặc "chứa các nhóm nguyên tử khác loại", trong đó (các) nguyên tử khác loại ((các) nhóm) được chọn từ N (các nhóm thế N), O và S (các nhóm thế S) như trong bản mô tả này được dùng để chỉ các gốc đơn vòng, các gốc đơn vòng này no, không no một phần hoặc thơm (không no hoàn toàn). Gốc dị vòng có thể được nối với phần còn lại của phân tử qua thành phần vòng cacbon hoặc qua thành phần vòng nitơ.

Các ví dụ về các vòng heteroxyclyl hoặc dị vòng no 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh bao gồm: oxiranyl, aziridiny, azetidiny, 2-tetrahydrofuranyl, 3-tetrahydrofuranyl, 2-tetrahydrothienyl, 3-tetrahydrothienyl, 2-pyrrolidiny, 3-pyrrolidiny, 3-pyrazolidiny, 4-pyrazolidiny, 5-pyrazolidiny, 2-imidazolidiny, 4-imidazolidiny, 2-oxazolidiny, 4-oxazolidiny, 5-oxazolidiny, 3-isoxazolidiny, 4-isoxazolidiny, 5-isoxazolidiny, 2-thiazolidiny, 4-thiazolidiny, 5-thiazolidiny, 3-isothiazolidiny, 4-isothiazolidiny, 5-isothiazolidiny, 1,2,4-oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-oxadiazolidin 5 yl, 1,2,4-thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-triazolidin-3-yl, 1,3,4-oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-triazolidin-2-yl, 2-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydropyranyl, 1,3-dioxan-5-yl, 1,4-dioxan-2-yl, 2-piperidiny, 3-piperidiny, 4-piperidiny, 3-hexahydropyridaziny, 4-hexahydropyridaziny, 2-hexahydropyrimidiny, 4-hexahydropyrimidiny, 5-hexahydropyrimidiny, 2-piperaziny, 1,3,5-hexahydrotriazin-2-yl và 1,2,4-hexahydrotriazin-3-yl, 2-morpholiny, 3-morpholiny, 2-thiomorpholiny, 3-thiomorpholiny, 1-oxothiomorpholin-2-yl, 1-oxothiomorpholin-3-yl, 1,1-dioxothiomorpholin-2-yl, 1,1-dioxothiomorpholin-3-yl, hexahydroazepin-1-, -2-, -3- hoặc -4-yl, hexahydrooxepiny, hexahydro-1,3-diazepiny, hexahydro-1,4-diazepiny, hexahydro-1,3-oxazepiny, hexahydro-1,4-oxazepiny, hexahydro-1,3-dioxepiny, hexahydro-1,4-dioxepiny và tương tự.

Các ví dụ về các vòng heteroxyclyl hoặc dị vòng không no một phần 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh bao gồm: 2,3-dihydrofur-2-yl, 2,3-dihydrofur-3-yl, 2,4-dihydrofur-2-yl, 2,4-dihydrofur-3-yl, 2,3-dihydrothien-2-yl, 2,3-dihydrothien-3-yl, 2,4-dihydrothien-2-yl, 2,4-dihydrothien-3-yl, 2-pyrolin-2-yl, 2-pyrolin-3-yl, 3-pyrolin-2-yl, 3-pyrolin-3-yl, 2-isoxazolin-3-yl, 3-isoxazolin-3-yl, 4-isoxazolin 3 yl, 2-isoxazolin-4-yl, 3-isoxazolin-4-yl, 4-isoxazolin-4-yl, 2-isoxazolin-5-yl, 3-isoxazolin-5-yl, 4-isoxazolin-5-yl, 2-isothiazolin-3-yl, 3-isothiazolin-3-yl, 4-isothiazolin-3-yl, 2-isothiazolin-4-yl, 3-isothiazolin-4-yl, 4-isothiazolin-4-yl, 2-isothiazolin-5-yl, 3-isothiazolin-5-yl, 4-isothiazolin-5-yl, 2,3 dihydropyrazol-1-yl, 2,3-dihydropyrazol-2-yl, 2,3-dihydropyrazol-3-yl, 2,3-dihydropyrazol-4-yl, 2,3-dihydropyrazol-5-yl, 3,4-dihydropyrazol-1-yl, 3,4-dihydropyrazol-3-yl, 3,4-dihydropyrazol-4-yl, 3,4-dihydropyrazol-5-yl, 4,5-dihydropyrazol-1-yl, 4,5-dihydropyrazol-3-yl, 4,5-dihydropyrazol-4-yl, 4,5-dihydropyrazol-5-yl, 2,3-dihydrooxazol-2-yl, 2,3-

dihydrooxazol-3-yl, 2,3-dihydrooxazol-4-yl, 2,3-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, 3,4-dihydrooxazol-5-yl, 3,4-dihydrooxazol-2-yl, 3,4-dihydrooxazol-3-yl, 3,4-dihydrooxazol-4-yl, 2-, 3-, 4-, 5- hoặc 6-di- hoặc tetrahydropyridinyl, 3-di- hoặc tetrahydropyridazinyl, 4-di- hoặc tetrahydropyridazinyl, 2-di- hoặc tetrahydropyrimidinyl, 4-di- hoặc tetrahydropyrimidinyl, 5-di- hoặc tetrahydropyrimidinyl, di- hoặc tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-di- hoặc tetrahydrotriazin-2-yl, 1,2,4-di- hoặc tetrahydrotriazin-3-yl, 2,3,4,5-tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, 3,4,5,6-tetrahydro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, 2,3,4,7-tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, 2,3,6,7-tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, tetrahydrooxepinyl, như 2,3,4,5-tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, 2,3,4,7-tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, 2,3,6,7-tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- hoặc -7-yl, tetrahydro-1,3-diazepinyl, tetrahydro-1,4-diazepinyl, tetrahydro-1,3-oxazepinyl, tetrahydro-1,4-oxazepinyl, tetrahydro-1,3-dioxepinyl và tetrahydro-1,4-dioxepinyl.

Các ví dụ về các vòng thơm dị vòng (hetaryl) hoặc dị vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh là: 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 5-pyrazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 1,3,4-triazol-2-yl, 2-pyridinyl, 3-pyridinyl, 4-pyridinyl, 3-pyridazinyl, 4-pyridazinyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl và 2-pyrazinyl.

"C₂-C_m-alkylen" là mạch béo no phân nhánh hoặc tốt hơn là không phân nhánh hóa trị hai có 2 đến m, ví dụ như 2 đến 7 nguyên tử cacbon, ví dụ CH₂CH₂, -CH(CH₃)-, CH₂CH₂CH₂, CH(CH₃)CH₂, CH₂CH(CH₃), CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, và CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂.

Các phương án và các hợp chất ưu tiên theo sáng chế để dùng trong các phương pháp chống lại loài gây hại và cho mục đích ứng dụng chống lại côn trùng được nêu trong các đoạn sau đây.

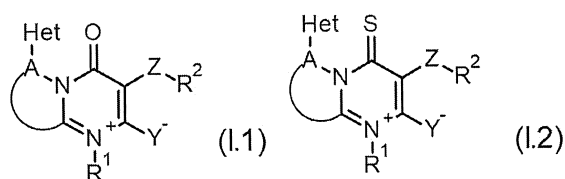
Các ghi chú thực hiện dưới đây liên quan đến các phương án ưu tiên của các biến (các phần tử thể) của hợp chất theo sáng chế, đặc biệt là so với các phần tử thể của chúng X, Y, Z, X¹, X², Y¹, A, R¹, R^a, R^{aa}, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R^{2a}, R^{2aa}, R³, m, n, p và Het có giá

trị cả chính chúng và, cụ thể là, trong tất cả kết hợp với nhau có thể và nơi mà có khả năng dùng, các ứng dụng, phương pháp và các chế phẩm theo sáng chế.

Theo phương án cụ thể, các biến của hợp chất có công thức (I) có ý nghĩa sau, các ý nghĩa này, cả chính chúng và kết hợp với cái khác, là các phương án cụ thể của hợp chất có công thức (I):

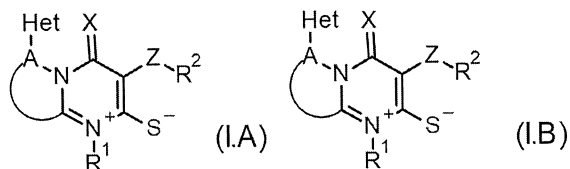
Theo một phương án ưu tiên của hợp chất có công thức (I), X là O. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức (I.1).

Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), X là S. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức (I.2).

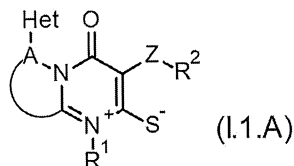


Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là S. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức (I.A).

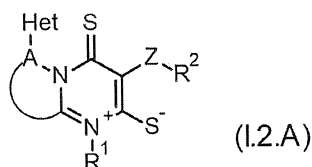
Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là O. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức (I.B).



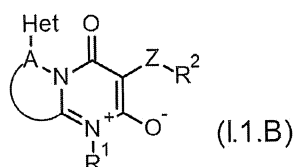
Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là S và X là O. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức I.1.A:



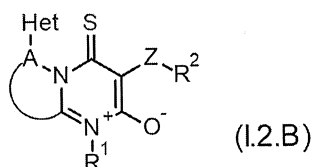
Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là S và X là S. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức I.2.A.



Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là O và X là O. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức I.1.B.



Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Y là O và X là S. Các hợp chất này tương ứng với hợp chất có công thức I.2.B.



Trong các phương án này, hợp chất có công thức I.1.B được ưu tiên.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), Z là liên kết trực tiếp hoặc C(R^aR^{aa})O.

Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), Z là liên kết trực tiếp.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), Z là O, S(O)_m, NR^b, C(=X¹), C(=X¹)Y¹, hoặc Y¹C(=X¹). Theo phương án khác, Z là O, S(O)_m, hoặc NR^b. Theo phương án khác, Z là C(=X¹), C(=X¹)Y¹, hoặc Y¹C(=X¹).

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), X¹ là O.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), X¹ là S.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), X¹ là NR^b.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), Y¹ là O.

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), Y¹ là S.

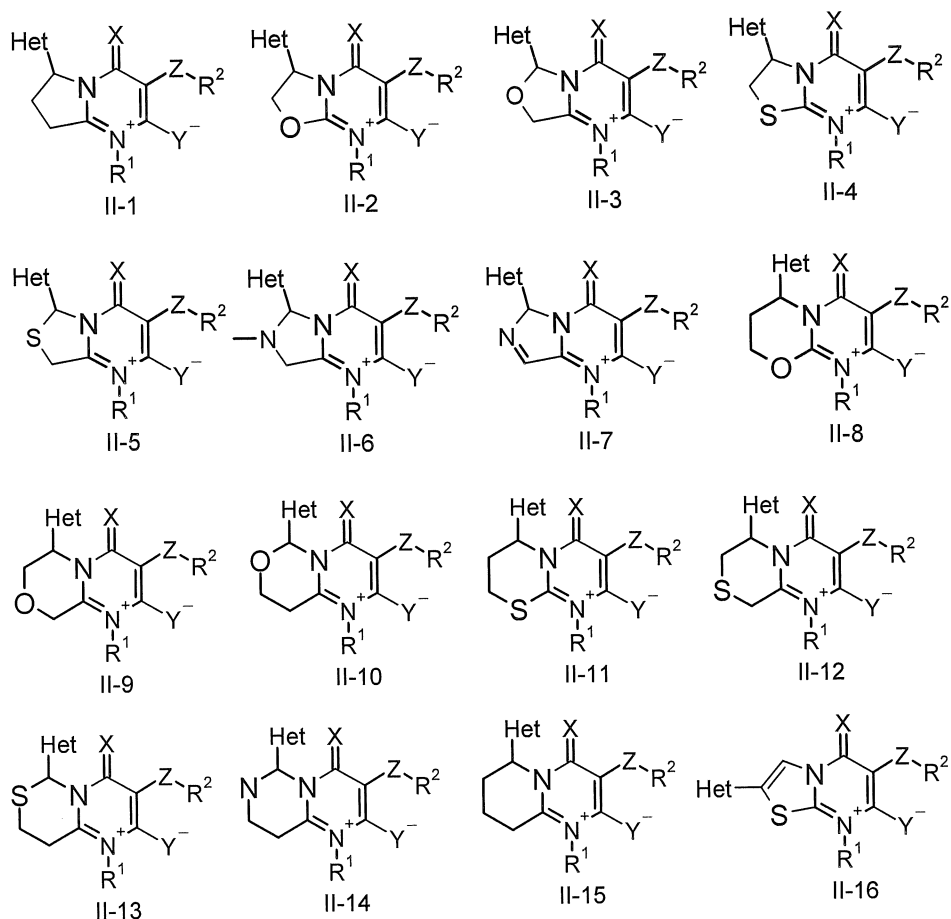
Theo phương án của hợp chất có công thức (I), Y^1 là NR^c .

Theo phương án của hợp chất có công thức (I), A là CH hoặc N, và trong đó nitơ của vòng pyrimidini kết hợp cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được nêu trong công thức (I), tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa một nguyên tử độc lập được chọn từ O, S, và $N(R^c)_p$, trong đó mỗi vòng có thể được thế bằng tối đa một R^a , trong đó R^a có nghĩa như được mô tả dưới đây.

Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), A là CH hoặc N, và trong đó nitơ của vòng pyrimidini kết hợp cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được mô tả trong công thức (I), tạo thành vòng năm cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa một nguyên tử độc lập được chọn từ O, S, và $N(R^c)_p$.

Theo phương án khác của hợp chất có công thức (I), A là CH hoặc N, và trong đó nitơ của vòng pyrimidini kết hợp cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được mô tả trong công thức (I), tạo thành vòng sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa một nguyên tử độc lập được chọn từ O, S, và $N(R^c)_p$.

Theo phương án khác, được ưu tiên là hợp chất có công thức (I), trong đó A là CH, và trong đó nitơ của vòng pyrimidini kết hợp cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được mô tả trong công thức (I), tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh thu được trong hợp chất có công thức (II) được chọn từ nhóm của hợp chất có các công thức II-1 đến II-15:



Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) được chọn từ nhóm của hợp chất có các công thức II-1, II-2, II-3, II-4, II-5, II-6, II-7 và II-15.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) được chọn từ nhóm gồm hợp chất có các công thức II-1, II-2, II-3, II-4, II-5, II-6 và II-7.

Theo phương án ưu tiên, hợp chất có công thức (I) là hợp chất có công thức II-1.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) là hợp chất có công thức II-15.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức (I) là hợp chất có công thức II-16.

Theo một phương án, R¹ là hydro, C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₄-C₁₀-xycloalkenyl hoặc C₅-C₁₁-xycloalkylxycloalkyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, hoặc được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^a, trong đó R^a có nghĩa như được mô tả dưới đây.

Theo phương án khác, R¹ là hệ vòng no, hoặc no một phần hoặc dị vòng từ ba đến mười cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ N(R^c)_p, O, và S,

trong đó S có thể được oxy hóa và vòng dị vòng có thể không được thế hoặc được thế bằng R^a.

Theo phương án khác, R¹ là hydro, C₁-C₄-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc C₅-C₁₁-xycloalkylxycloalkyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, hoặc được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen.

Theo phương án khác R¹ là C₁-C₄-alkyl, C₂-C₈-alkenyl, C₃-C₆-xycloalkyl, phenyl hoặc benzyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, hoặc được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^a, trong đó R^a có nghĩa như được nêu ở dưới.

Theo phương án khác R¹ là C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc phenyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, hoặc được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen hoặc C₁-C₄-alkyl.

Theo phương án khác R¹ là C₁-C₄-alkyl, C₂-C₄-alkenyl, phenyl hoặc benzyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen, tốt hơn là Cl hoặc F.

Theo phương án khác R¹ là C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl hoặc phenyl, tốt hơn là CH₃, CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, xyclopropyl hoặc phenyl.

Theo phương án khác R¹ là C₁-C₃-alkyl, tốt hơn là CH₃, CH₂CH₃ hoặc CH(CH₃)₂; cụ thể là R¹ là CH₂CH₃.

Theo một phương án, R² là hydro, halogen, CN, NO₂, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₅-C₆-xycloalkenyl, C₅-C₁₄-xycloalkylxycloalkyl hoặc S(O)_mR^b, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, hoặc được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a}.

Theo một phương án, R² là hydro, halogen, CN, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₂-alkoxy-C₁-C₂-alkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể được thế bằng halogen hoặc CN.

Theo một phương án, R² là hydro, halogen, CN hoặc C₁-C₄-alkyl có thể được thế

bằng halogen.

Theo phương án khác R^2 là CN.

Theo phương án khác, R^2 là hydro hoặc C_1 - C_2 -alkyl, cụ thể là CH_3 .

Theo phương án khác, R^2 là C_1 - C_6 -haloalkyl, tốt hơn là C_1 - C_2 -haloalkyl, cụ thể là halomethyl, như CF_3 hoặc CHF_2 .

Theo phương án khác, R^2 là C_1 - C_2 -alkoxy- C_1 - C_2 -alkyl, tốt hơn là C_1 - C_2 -alkoxymethyl, cụ thể là CH_2OCH_3 .

Theo phương án khác, R^2 là C_3 - C_6 -xycloalkyl, tốt hơn là xyclopropyl có thể được thế, tốt hơn là bằng halogen hoặc xyano.

Theo phương án khác, R^2 là C_2 - C_6 -alkyl, tốt hơn là C_2 - C_4 -alkyl, cụ thể là CH_2CH_3 hoặc $C(CH_3)_3$.

Theo phương án khác, R^2 là C_1 - C_6 -alkyl, tốt hơn là C_1 - C_2 -alkyl, cụ thể là CH_3 .

Theo phương án khác, R^2 là halogen, tốt hơn là Cl hoặc F, cụ thể là F.

Theo phương án khác, R^2 là vòng cacbon hoặc dị vòng năm hoặc sáu cạnh, vòng có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , và trong đó R^{2a} như được xác định dưới đây hoặc R^{2a} tốt hơn là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, OR^c , $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, phenyl, hoặc pyridyl có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy.

Theo phương án khác, R^2 là vòng cacbon hoặc dị vòng sáu cạnh, vòng có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , và trong đó R^{2a} là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, OR^c , $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, phenyl, hoặc pyridyl có thể được thế bằng R^{2aa} , trong đó R^{2aa} như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, R^2 là vòng cacbon vòng thơm sáu cạnh, vòng có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , và trong đó R^{2a} là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, OR^c , $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, phenyl, hoặc pyridyl có thể được thế bằng R^{2aa} , trong đó R^{2aa} như được xác định dưới đây, tốt hơn là R^{2aA} là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy.

Trong phương án này, R^2 là phenyl có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -

haloalkyl hoặc C₁-C₆-haloalkoxy.

Ngoài ra, trong phương án này R² là phenyl có thể được thế bằng phenyl.

Theo phương án khác, R² là vòng dị vòng sáu cạnh, chứa 1 hoặc 2, tốt hơn là 1, (các) nguyên tử khác loại được chọn từ N-R^c, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, vòng dị vòng không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều nhóm R^{2a}, trong đó R^{2a} như được xác định dưới đây.

Theo một phương án, R^a là halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, CN, OR^c, NR^bR^c, NO₂, phenyl, pyridyl, thiazyl, furanyl, pyrimidinyl hoặc thienyl, trong đó nguyên tử C đã nêu ở trên các nhóm có thể không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R^{aa}, trong đó R^{aa} là như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, R^a là halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl.

Theo phương án khác, R^a là halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl hoặc C₃-C₆-xycloalkyl.

Theo phương án khác, R^a là halogen.

Theo một phương án, R^a là halogen, CN, NO₂, S(O)_mR^b, C(O)R^c, C(O)OR^c, C(O)NR^bR^c, C(=S)NR^bR^c, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy hoặc C₂-C₆-alkynyloxy, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa}, trong đó như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, R^a là halogen, CN, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy hoặc C₂-C₆-alkynyloxy, nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa}, trong đó R^{aa} như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, R^a là halogen, CN, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy hoặc C₂-C₆-alkynyloxy, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen.

Theo phương án khác, R^a là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc C_1 - C_6 -alkoxy.

Theo phương án khác, R^a là halogen, CN hoặc C_1 - C_2 -haloalkyl.

Theo phương án khác, R^a là halogen hoặc C_1 - C_2 -haloalkyl.

Theo một phương án, R^a là halogen, tốt hơn là Br, Cl hoặc F, cụ thể là Cl.

Theo phương án khác, R^a là C_1 - C_2 -haloalkyl, tốt hơn là halometyl như CHF_2 hoặc CF_3 , cụ thể là CF_3 .

Theo một phương án, hai nhóm R^a được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

Theo phương án khác, hai nhóm R^a được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

Theo phương án khác, hai nhóm R^a được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O$, $=S$ và $=N(C_1$ - C_6 -alkyl).

Theo phương án khác, hai nhóm R^a được gắn vào cùng một nguyên tử có thể cùng tạo thành nhóm $=N(C_1$ - C_6 -alkyl).

Theo một phương án, R^b là hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, phenyl, pyridyl, thiazyl hoặc thienyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể được thế bằng R^{aa} , trong đó R^{aa} như được xác định dưới đây. Theo phương án khác, R^b là hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy. Theo phương án khác, R^b là hydro, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án, R^b là C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án, R^b là H.

Theo một phương án, R^c là hydro, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -xycloalkyl, phenyl, pyridyl, thiazyl hoặc thienyl trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể được thế bằng R^{aa} , trong đó R^{aa} như được xác định dưới đây. Theo phương án khác, R^c là hydro, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyl, hoặc C_1 - C_6 -xycloalkyl. Theo một phương án, R^c là hydro, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án, R^c là C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo một phương án, R^c là H.

Theo một phương án, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^bR^b , R^cR^b

hoặc R^cR^c cùng với nguyên tử mà chúng liên kết, có thể tạo thành vòng cacbon hoặc dị vòng no, không no một phần hoặc thơm 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh, có thể chứa 1 đến 2 nguyên tử hoặc nhóm nguyên tử khác loại được chọn từ N, O, S, NO, SO và SO_2 và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^3 .

Theo phương án khác, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^bR^b , R^cR^b hoặc R^cR^c cùng với nguyên tử mà chúng liên kết, có thể tạo thành vòng cacbovòng no, no một phần hoặc thơm 5 hoặc 6 cạnh, vòng này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^3 , và trong đó R^3 như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^bR^b , R^cR^b hoặc R^cR^c cùng với nguyên tử mà chúng liên kết, có thể tạo thành vòng dị vòng no, không no một phần hoặc thơm 5 hoặc 6 cạnh, có thể chứa 1 đến 2 nguyên tử hoặc nhóm nguyên tử khác loại được chọn từ N, O, S, NO, SO và SO_2 , trong đó dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^3 , và trong đó R^3 như được xác định dưới đây.

Theo một phương án, R^d là hydro, phenyl, C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_2 - C_6 -alkenyl, trong đó các nhóm nêu trên có thể được thế bằng một hoặc nhiều halogen. Theo phương án khác, R^d là C_1 - C_4 -alkyl hoặc phenyl, có thể được thế bằng halogen. Theo phương án khác, R^e là C_1 - C_4 -alkyl, tốt hơn là CH_3 .

Theo một phương án, R^e là C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcacbonyl, C_1 - C_6 xycloalkyl, phenyl, pyridyl, thiazyl hoặc thienyl trong đó các nhóm nêu trên có thể được thế bằng R^{aa} , trong đó R^{aa} như được xác định dưới đây. Theo phương án khác, R^e là C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcacbonyl, hoặc C_1 - C_6 -xycloalkyl. Theo phương án khác, R^e là C_1 - C_4 -alkyl hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl.

Theo một phương án, R^{aa} là halogen, C_1 - C_6 -alkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo phương án khác, R^{aa} là C_1 - C_6 -alkoxy hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy. Theo một phương án, R^{aa} là halogen.

Theo một phương án, R^{2a} là halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, OR^c , $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, hoặc phenyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R^{2aa} , trong đó

R^{2aa} như được xác định dưới đây, cụ thể là R^{2a} là halogen, C_1 - C_6 -alkoxy, hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy.

Theo một phương án, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^{2a} có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O$, $=S$ và $=N(C_1-C_6-alkyl)$.

Theo một phương án, R^{2a} là halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , phenyl, pyridyl, thiazyl, furanyl, pyrimidinyl hoặc thienyl, trong đó nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế hoặc được thế bằng một hoặc nhiều R^{2aa} , trong đó R^{2aa} như được xác định dưới đây.

Theo phương án khác, R^{2a} là halogen, C_1 - C_4 -haloalkyl hoặc C_3 - C_6 -haloalkoxy.

Theo phương án khác, R^{2a} là phenyl có thể được thế bằng một hoặc nhiều R^{2aa} .

Theo phương án khác, R^{2a} là halogen. Theo phương án khác, R^{2a} là C_1 - C_6 -haloalkyl. Theo phương án khác, R^{2a} là C_1 - C_6 -haloalkoxy.

Theo phương án khác, R^{2a} là halogen, CN, NO_2 , $S(O)_mR^b$, $C(=O)R^c$, $C(=O)OR^c$, $C(O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy hoặc C_2 - C_6 -alkynyloxy, nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} , mà như được xác định ở dưới.

Theo phương án khác, R^{2a} là, $C(=O)OR^c$ hoặc $C(=O)NR^bR^c$.

Theo phương án khác, R^{2a} là halogen, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy hoặc C_2 - C_6 -alkynyloxy, nguyên tử C của các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2aa} , trong đó R^{2aa} như được xác định dưới đây.

Theo một phương án, R^{2a} là Br, Cl hoặc F, cụ thể là Cl.

Theo phương án khác, R^{2a} là C_1 - C_2 -haloalkyl, tốt hơn là halometyl như CHF_2 hoặc CF_3 , cụ thể là CF_3 .

Theo một phương án, R^{2aa} là halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, $N(C_1$ -

$C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)(O)_p(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), S(O)_m(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), SO_2N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), OSO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})SO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}),$ hoặc $S(=O)_p(=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl)})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$ hoặc hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^{2aa} có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O, =S$ và $=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$.

Theo một phương án, R^{2aa} là halogen, $C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-alkoxy}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkoxy}, C_2\text{-}C_4\text{-alkenyl}, C_2\text{-}C_4\text{-alkynyl}, C_3\text{-}C_6\text{-xycloalkyl}, CN, N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)(O)_p(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), S(O)_m(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), SO_2N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), OSO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})SO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}),$ hoặc $S(=O)_p(=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl)})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$. Theo phương án khác, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^{2aa} có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O, =S$ và $=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$.

Theo một phương án, R^3 là halogen, $C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-alkoxy}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkoxy}, C_2\text{-}C_4\text{-alkenyl}, C_2\text{-}C_4\text{-alkynyl}, C_3\text{-}C_6\text{-xycloalkyl}, CN, N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)(O)_p(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), S(O)_m(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), SO_2N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), OSO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})SO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), S(=O)_p(=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl)})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}),$ hoặc

hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^3 có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O, =S$ và $=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$.

Theo một phương án, R^{3a} là halogen, $C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkyl}, C_1\text{-}C_6\text{-alkoxy}, C_1\text{-}C_6\text{-haloalkoxy}, C_2\text{-}C_4\text{-alkenyl}, C_2\text{-}C_4\text{-alkynyl}, C_3\text{-}C_6\text{-xycloalkyl}, CN, N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)(O)_p(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), C(=O)N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), S(O)_m(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), SO_2N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), OSO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}), N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})SO_2(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl}),$ hoặc $S(=O)_p(=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl)})(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$. Theo phương án khác, hai nhóm được gắn vào cùng một nguyên tử R^{3a} có thể cùng tạo thành nhóm được chọn từ $=O, =S$ và $=N(C_1\text{-}C_6\text{-alkyl})$.

Theo một phương án, m là 0. Theo phương án khác, m là 1. Theo phương án khác, m là 2.

Theo một phương án, n là 0. Theo phương án khác, n là 1. Theo phương án khác, n là 2.

Theo một phương án, p là 0. Theo phương án khác, p là 1.

Theo một phương án Het là vòng dị vòng no, không no một phần hoặc thơm năm hoặc sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$ và các biến còn lại ở nghĩa của Het được xác định như trên.

Theo một phương án Het là vòng dị vòng no, không no một phần hoặc thơm năm hoặc sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 2 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$.

Theo một phương án Het là vòng dị vòng thơm năm cạnh, chứa 2 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$.

Theo một phương án Het là vòng dị vòng no năm cạnh, chứa 1 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, tốt hơn là O, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$.

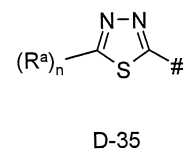
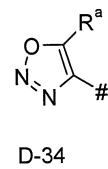
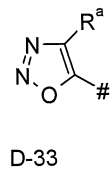
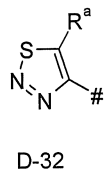
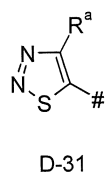
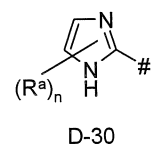
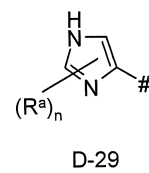
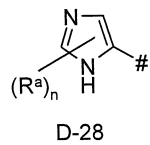
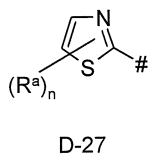
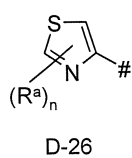
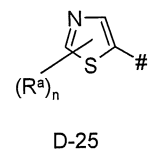
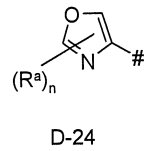
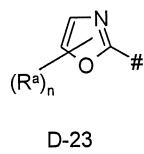
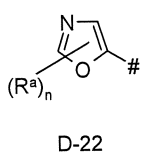
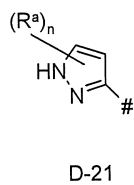
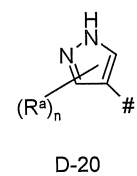
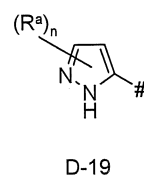
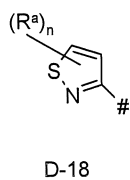
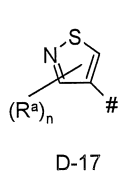
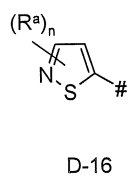
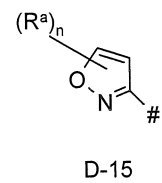
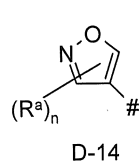
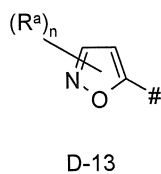
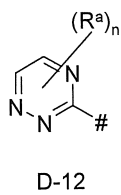
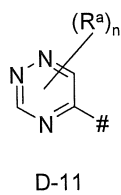
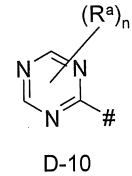
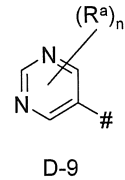
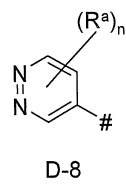
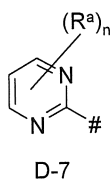
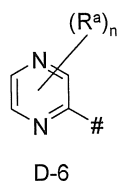
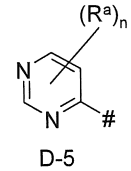
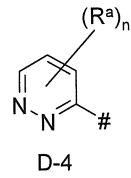
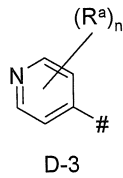
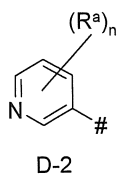
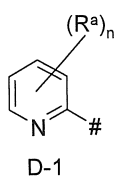
Theo một phương án Het là vòng dị vòng thơm sáu cạnh, chứa 2 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, tốt hơn là $N(R^c)_p$, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$.

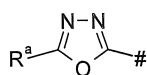
Theo một phương án Het là vòng dị vòng thơm sáu cạnh, chứa 1 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O và S, tốt hơn là $N(R^c)_p$, trong đó vòng dị vòng được thế bằng $(R^a)_n$.

Theo một phương án Het là pyridyl được thế bằng $(R^a)_n$.

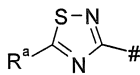
Theo một phương án Het là tetrahydrofuryl được thế bằng $(R^a)_n$.

Theo phương án khác, Het được chọn từ hệ vòng bất kỳ trong số các hệ từ D-1 đến D-56:

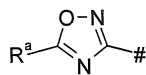




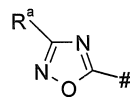
D-36



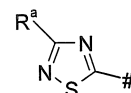
D-37



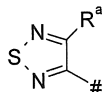
D-38



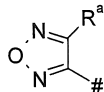
D-39



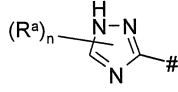
D-40



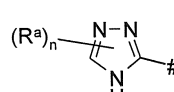
D-41



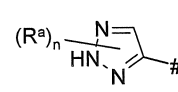
D-42



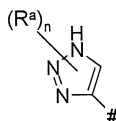
D-43



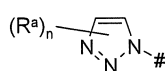
D-44



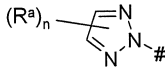
D-45



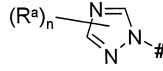
D-46



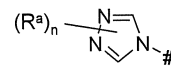
D-47



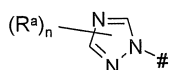
D-48



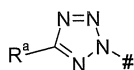
D-49



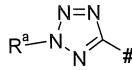
D-50



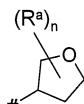
D-51



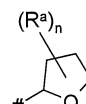
D-52



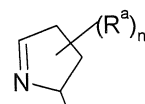
D-53



D-54



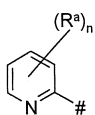
D-55



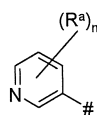
D-56

Được sử dụng ở bất cứ nơi nào trong cấu trúc, ký hiệu # dùng để chỉ liên kết với A ở công thức (I)

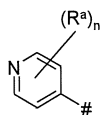
Theo phương án khác Het được chọn từ hệ bất kỳ trong số các hệ vòng sau:



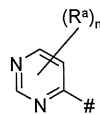
D-1



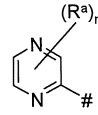
D-2



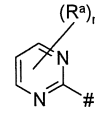
D-3



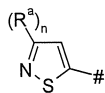
D-5



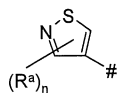
D-6



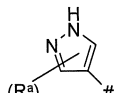
D-7



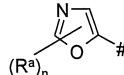
D-16



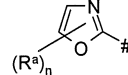
D-17



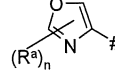
D-20



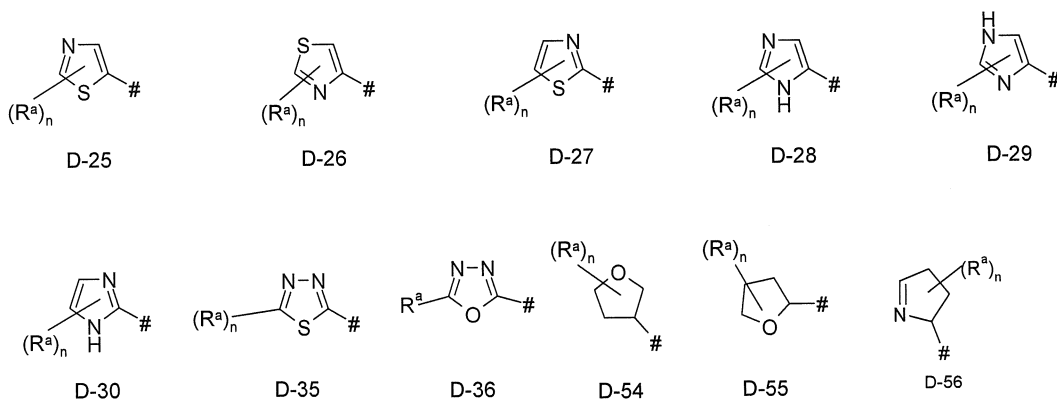
D-22



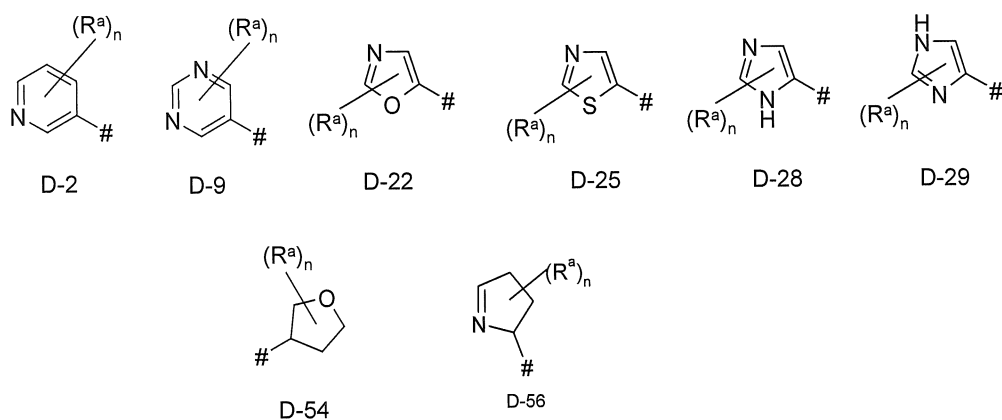
D-23



D-24

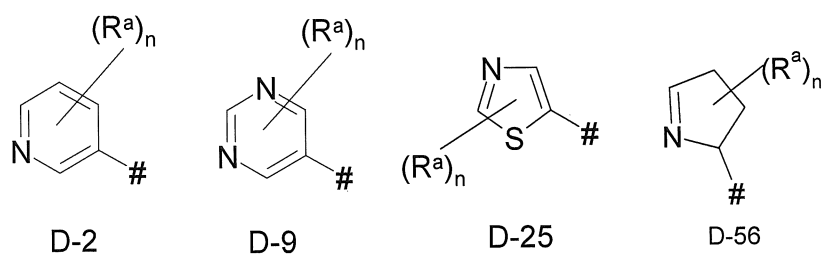


Theo phương án khác, Het được chọn từ các hệ vòng D-2, D-9, D-22, D-25, D-28, D-29 và D-54 sau:



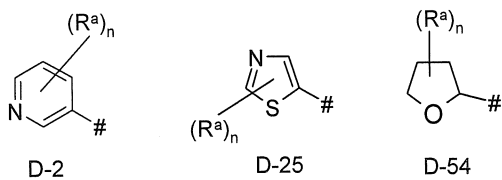
trong đó R^a là halogen, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -alkylthio hoặc phenyl; tốt hơn là R^a là halogen hoặc halometyl.

Theo phương án khác, Het được chọn từ các hệ vòng D-2, D-9 và D-25 sau:



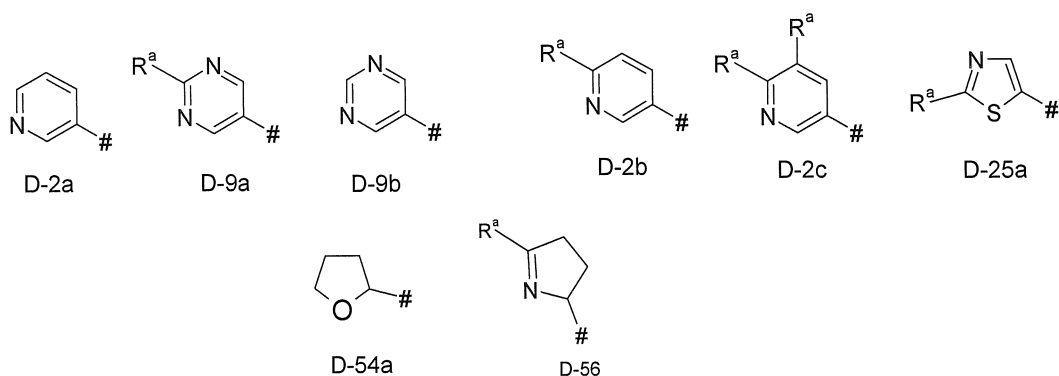
trong đó R^a là halogen, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -alkylthio hoặc phenyl, tốt hơn là halogen hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl; tốt hơn nữa là R^a là Cl, Br, F hoặc CF_3 , càng tốt hơn là R^a là Cl hoặc CF_3 .

Theo phương án khác Het được chọn từ các hệ vòng D-2, D-25 hoặc D-54 sau:



trong đó R^a là halogen hoặc C_1 - C_4 -haloalkyl; tốt hơn là R^a là Cl, Br, F hoặc CF_3 , càng tốt hơn là R^a là Cl hoặc CF_3 .

Theo phương án khác Het được chọn từ các hệ vòng D-2a, D-2b, D-2c, D-25a và D-54a sau:



trong đó R^a độc lập được chọn từ Cl, Br, F và CF_3 .

Theo phương án khác Het là D-2, tốt hơn là D-2b hoặc D-2c, cụ thể là D-2b, trong đó R^a là Cl hoặc CF_3 .

Theo phương án khác Het là D-2a.

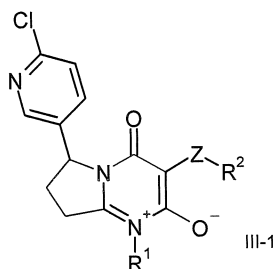
Theo phương án khác, Het là D-25, tốt hơn là D-25a được thế bằng Cl.

Theo phương án khác, Het là D-9, tốt hơn là D-9a hoặc D-9b.

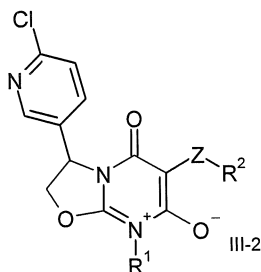
Theo phương án khác, Het là D-56, tốt hơn là D-56a.

Đặc biệt, xem xét ứng dụng của chúng, sự ưu tiên được dành cho các hợp chất có công thức (I) được nêu trong bảng dưới đây, các hợp chất tương ứng với các hợp chất có các công thức I.1.B (nghĩa là trong đó X và Y là O) và với các hợp chất ưu tiên có công thức II-1, II-2, II-3, II-4, II-5, II-6, II-7, và II-15. Mỗi nhóm đề cập các phần tử thế trong bảng cũng độc lập với tổ hợp trong đó chúng được đề cập, khía cạnh được đặc biệt ưu tiên của phần tử thế được đề cập. Ngoài ra, mỗi nghĩa riêng rẽ của phần tử thế trong bảng tạo thành phương án được đặc biệt ưu tiên của các phần tử thế được đề cập.

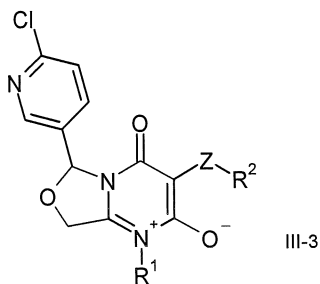
Bảng 1: Hợp chất có công thức (III-1) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



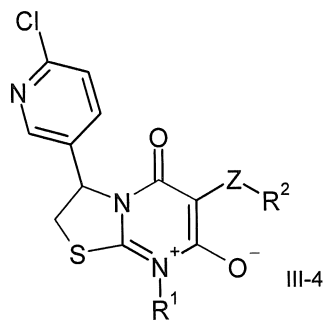
Bảng 2: Hợp chất có công thức (III-2) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



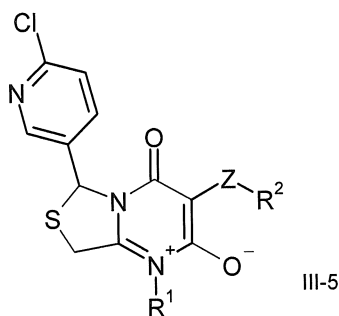
Bảng 3: Hợp chất có công thức (III-3) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



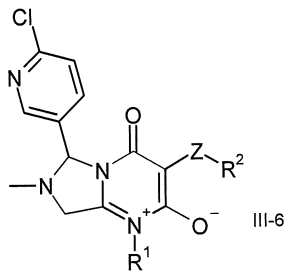
Bảng 4: Hợp chất có công thức (III-4) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



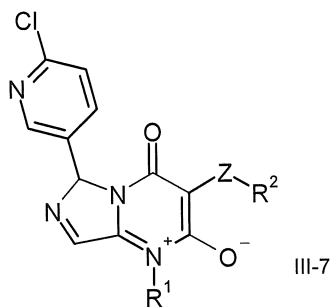
Bảng 5: Hợp chất có công thức (III-5) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



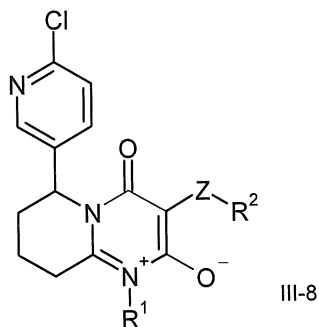
Bảng 6: Hợp chất có công thức (III-6) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



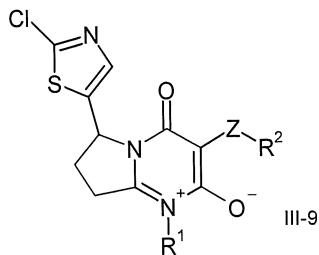
Bảng 7: Hợp chất có công thức (III-7) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



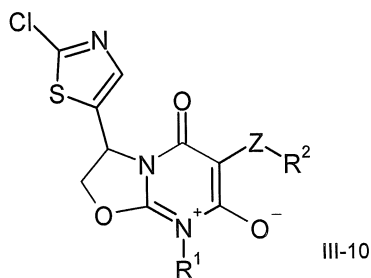
Bảng 8: Hợp chất có công thức (III-8) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



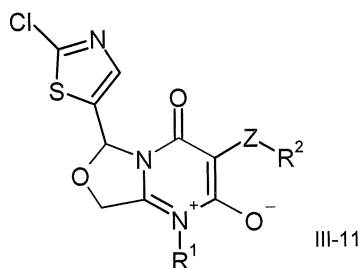
Bảng 9: Hợp chất có công thức (III-9) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



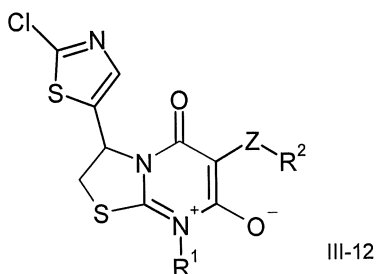
Bảng 10: Hợp chất có công thức (III-10) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



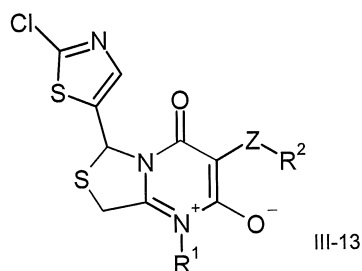
Bảng 11: Hợp chất có công thức (III-11) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



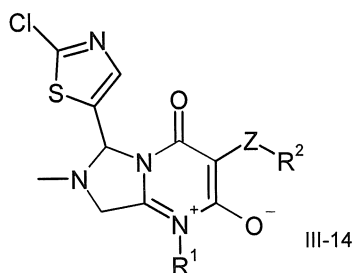
Bảng 12: Hợp chất có công thức (III-12) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



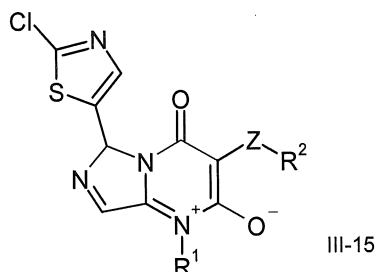
Bảng 13: Hợp chất có công thức (III-13) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A..



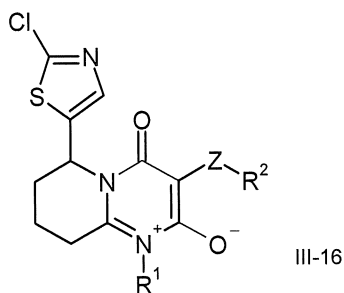
Bảng 14: Hợp chất có công thức (III-14) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



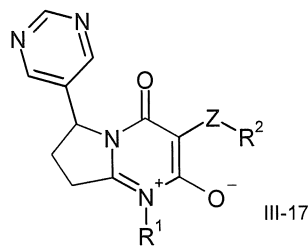
Bảng 15: Hợp chất có công thức (III-15) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



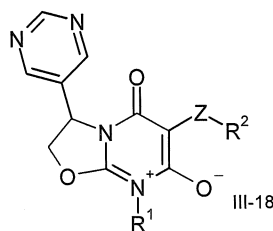
Bảng 16: Hợp chất có công thức (III-16) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



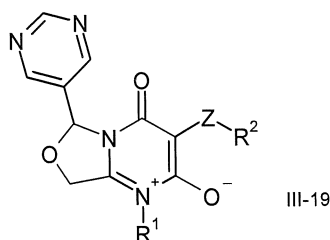
Bảng 17: Hợp chất có công thức (III-17) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



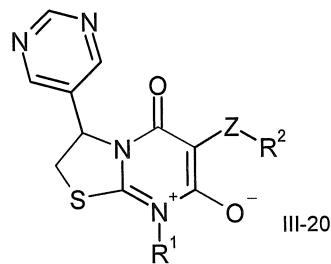
Bảng 18: Hợp chất có công thức (III-18) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



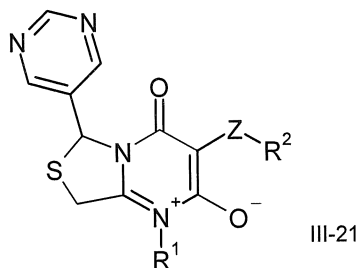
Bảng 19: Hợp chất có công thức (III-19) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



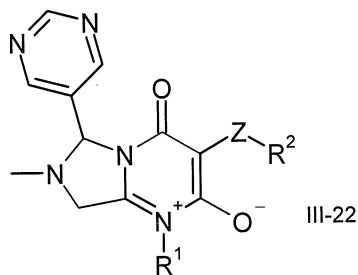
Bảng 20: Hợp chất có công thức (III-20) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



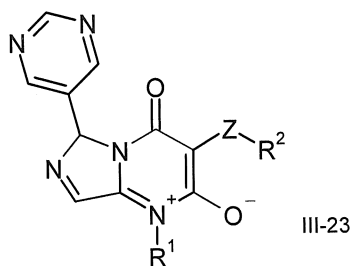
Bảng 21: Hợp chất có công thức (III-21) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



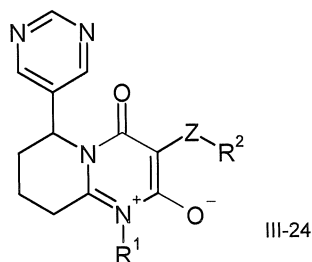
Bảng 22: Hợp chất có công thức (III-22) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



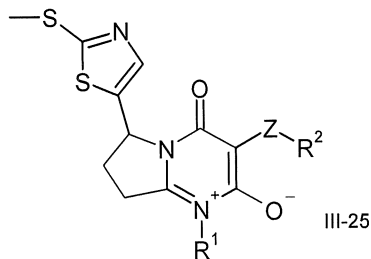
Bảng 23: Hợp chất có công thức (III-23) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



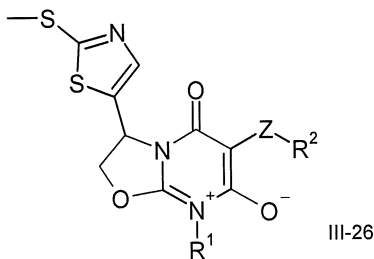
Bảng 24: Hợp chất có công thức (III-24) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



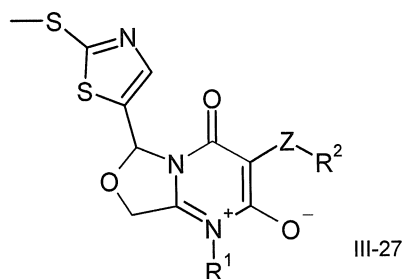
Bảng 25: Hợp chất có công thức (III-25) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



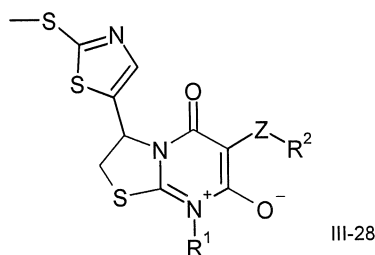
Bảng 26: Hợp chất có công thức (III-26) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



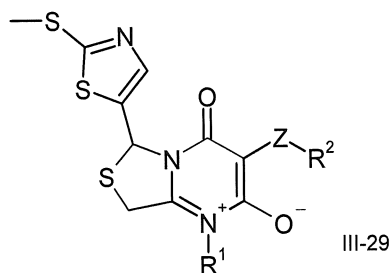
Bảng 27: Hợp chất có công thức (III-27) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



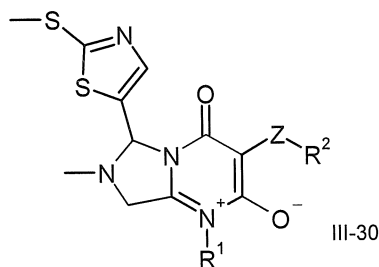
Bảng 28: Hợp chất có công thức (III-28) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



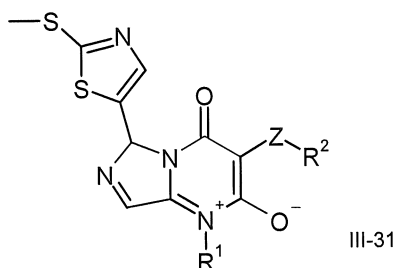
Bảng 29: Hợp chất có công thức (III-29) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



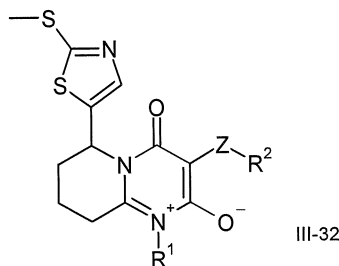
Bảng 30: Hợp chất có công thức (III-30) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



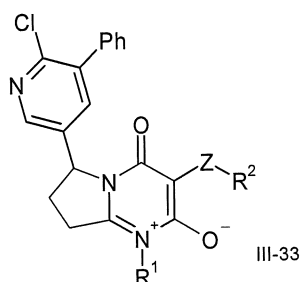
Bảng 31: Hợp chất có công thức (III-31) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



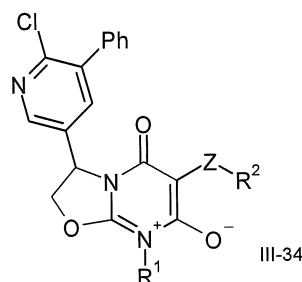
Bảng 32: Hợp chất có công thức (III-32) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-CH₃, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



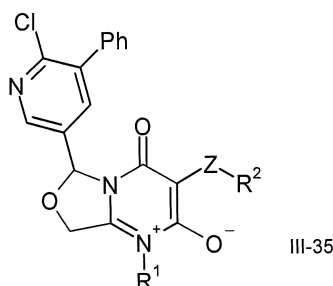
Bảng 33: Hợp chất có công thức (III-33) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và Phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



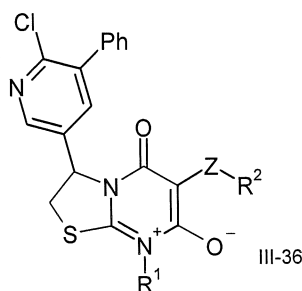
Bảng 34: Hợp chất có công thức (III-34) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và Phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



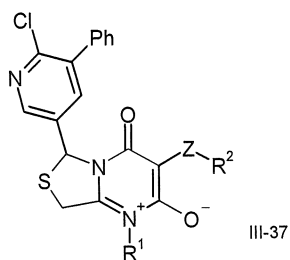
Bảng 35: Hợp chất có công thức (III-35) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



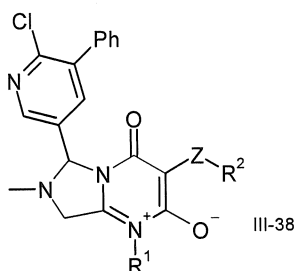
Bảng 36: Hợp chất có công thức (III-36) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



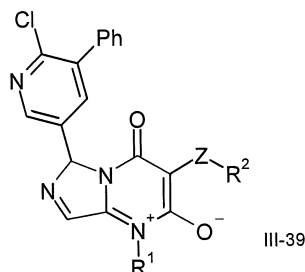
Bảng 37: Hợp chất có công thức (III-37) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



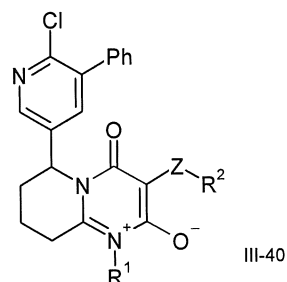
Bảng 38: Hợp chất có công thức (III-38) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



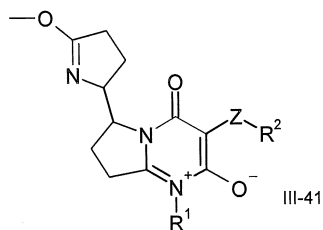
Bảng 39: Hợp chất có công thức (III-39) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



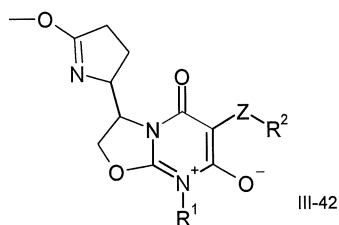
Bảng 40: Hợp chất có công thức (III-40) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



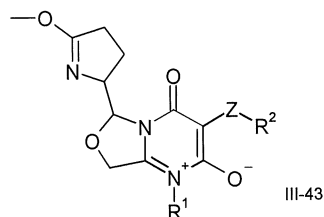
Bảng 41: Hợp chất có công thức (III-41) tương ứng với hợp chất có công thức II-1, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



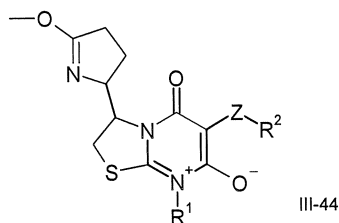
Bảng 42: Hợp chất có công thức (III-42) tương ứng với hợp chất có công thức II-2, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



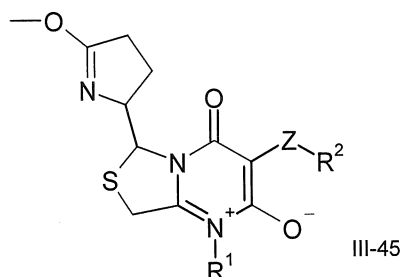
Bảng 43: Hợp chất có công thức (III-43) tương ứng với hợp chất có công thức II-3, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



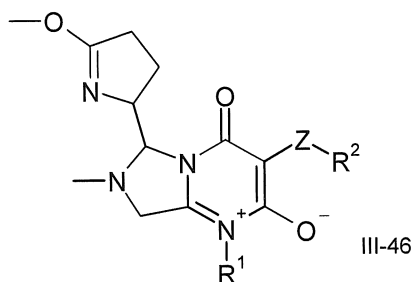
Bảng 44: Hợp chất có công thức (III-12) tương ứng với hợp chất có công thức II-4, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



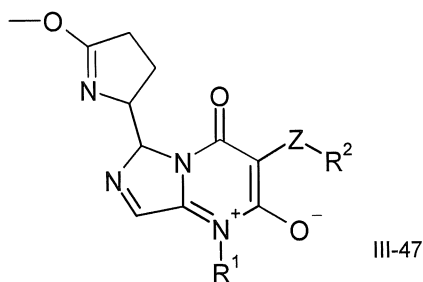
Bảng 45: Hợp chất có công thức (III-45) tương ứng với hợp chất có công thức II-5, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



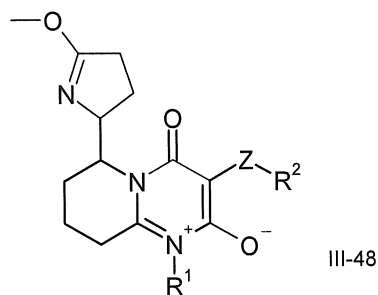
Bảng 46: Hợp chất có công thức (III-46) tương ứng với hợp chất có công thức II-6, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



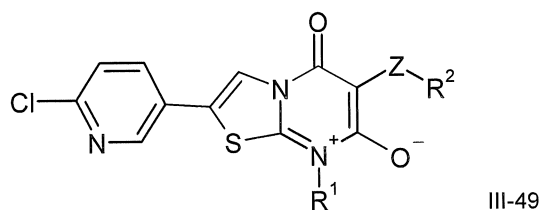
Bảng 47: Hợp chất có công thức (III-47) tương ứng với hợp chất có công thức II-7, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



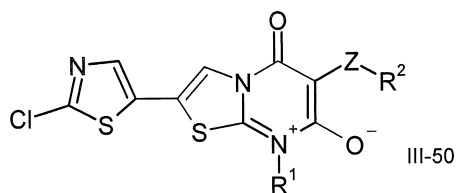
Bảng 48: Hợp chất có công thức (III-48) tương ứng với hợp chất có công thức II-15, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R^1 , ZR^2 trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A.



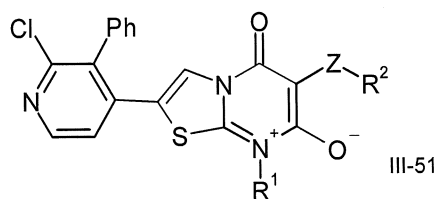
Bảng 49: Hợp chất có công thức (III-49) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-2b trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



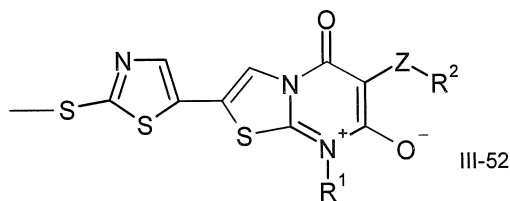
Bảng 50: Hợp chất có công thức (III-50) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là Cl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



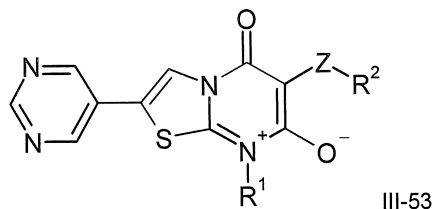
Bảng 51: Hợp chất có công thức (III-51) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-2c trong đó R^a là Cl và Phenyl, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



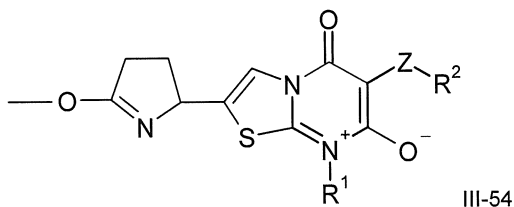
Bảng 52: Hợp chất có công thức (III-52) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-25a trong đó R^a là S-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



Bảng 53: Hợp chất có công thức (III-53) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-9b, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



Bảng 54: Hợp chất có công thức (III-54) tương ứng với hợp chất có công thức II-16, trong đó X và Y là O, Het là D-56a trong đó R^a là O-Me, và tổ hợp của R¹, ZR² trong mỗi trường hợp cho hợp chất tương ứng với một dòng của bảng A:



Bảng A:

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-1	C ₆ H ₅	CH ₃
A-2	2-flophenyl	CH ₃
A-3	2-metoxyphenyl	CH ₃

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-4	2,4-diflophenyl	CH ₃
A-5	2,6-diflophenyl	CH ₃
A-6	4-flophenyl	CH ₃
A-7	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-8	C(O)CF ₃	CH ₃
A-9	C(O)C ₆ H ₅	CH ₃
A-10	3-metoxyphephenyl	CH ₃
A-11	3-xyanophenyl	CH ₃
A-12	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phenyl	CH ₃
A-13	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phenyl	CH ₃
A-14	3-(triflometyl)phenyl	CH ₃
A-15	3-(triflometoxy)phenyl	CH ₃
A-16	3,5-diclophenyl	CH ₃
A-17	3-flo-5-metylphenyl	CH ₃
A-18	2-metoxy-5(triflometyl)phenyl	CH ₃
A-19	3-clo-5(triflometyl)phenyl	CH ₃
A-20	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)phenyl	CH ₃
A-21	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-4-flophenyl	CH ₃
A-22	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-5-	CH ₃

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
	methylphenyl	
A-23	3-phenylphenyl	CH ₃
A-24	4-metoxypheyl	CH ₃
A-25	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl)phenyl	CH ₃
A-26	C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-27	2-flophenyl	CH ₂ CH ₃
A-28	2-metoxypheyl	CH ₂ CH ₃
A-29	2,4-diflophenyl	CH ₂ CH ₃
A-30	2,6-diflophenyl	CH ₂ CH ₃
A-31	4-flophenyl	CH ₂ CH ₃
A-32	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-33	C(O)CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-34	C(O)C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-35	3-metoxypheyl	CH ₂ CH ₃
A-36	3-xyanophenyl	CH ₂ CH ₃
A-37	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-38	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-39	3-(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-40	3-(triflometoxy)phenyl	CH ₂ CH ₃

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-41	3,5-diclophenyl	CH ₂ CH ₃
A-42	3-flo-5-metylphenyl	CH ₂ CH ₃
A-43	2-metoxo-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-44	3-clo-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-45	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)phenyl	CH ₂ CH ₃
A-46	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-4-flophenyl	CH ₂ CH ₃
A-47	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-5-metylphenyl	CH ₂ CH ₃
A-48	3-phenylphenyl	CH ₂ CH ₃
A-49	4-metoxo-phenyl	CH ₂ CH ₃
A-50	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl-phenyl	CH ₂ CH ₃
A-51	C ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-52	2-flophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-53	2-metoxo-phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-54	2,4-diflophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-55	2,6-diflophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-56	4-flophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-57	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-58	C(O)CF ₃	CH(CH ₃) ₂

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-59	C(O)C ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-60	3-metoxyphenyl	CH(CH ₃) ₂
A-61	3-xyanophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-62	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-63	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-64	3-(triflometyl)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-65	3-(triflometoxy)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-66	3,5-diclophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-67	3-flo-5-metylphenyl	CH(CH ₃) ₂
A-68	2-metoxy-5(triflometyl)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-69	3-clo-5(triflometyl)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-70	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)phenyl	CH(CH ₃) ₂
A-71	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-4-flophenyl	CH(CH ₃) ₂
A-72	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-5-metylphenyl	CH(CH ₃) ₂
A-73	3-phenylphenyl	CH(CH ₃) ₂
A-74	4-metoxyphenyl	CH(CH ₃) ₂
A-75	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl-phenyl)	CH(CH ₃) ₂
A-76	C ₆ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-77	2-flophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-78	2-metoxyphenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-79	2,4-diflophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-80	2,6-diflophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-81	4-flophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-82	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-83	C(O)CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-84	C(O)C ₆ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-85	3-metoxyphenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-86	3-xyanophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-87	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-88	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-89	3-(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-90	3-(triflometoxy)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-91	3,5-diclophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-92	3-flo-5-metylphenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-93	2-metoxy-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-94	3-clo-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-95	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-96	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-4-flophenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-97	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-5-metylphenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-98	3-phenylphenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-99	4-metoxyphephenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-100	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl)phenyl	CH ₂ CH=CH ₂
A-101	C ₆ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-102	2-flophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-103	2-metoxyphephenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-104	2,4-diflophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-105	2,6-diflophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-106	4-flophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-107	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-108	C(O)CF ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-109	C(O)C ₆ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-110	3-metoxyphephenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-111	3-xyanophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-112	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-113	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-114	3-(triflometyl)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-115	3-(triflometoxy)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-116	3,5-diclophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-117	3-flo-5-metylphenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-118	2-metoxy-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-119	3-clo-5(triflometyl)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-120	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-121	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-4-flophenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-122	3-(2-clo-4-(triflometyl)phenyl)-5-metylphenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-123	3-phenylphenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-124	4-metoxyphenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-125	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl)phenyl	CH ₂ C ₆ H ₅
A-126	C ₆ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-127	2-flophenyl	CH ₂ CF ₃
A-128	2-metoxyphenyl	CH ₂ CF ₃
A-129	2,4-diflophenyl	CH ₂ CF ₃
A-130	2,6-diflophenyl	CH ₂ CF ₃
A-131	4-flophenyl	CH ₂ CF ₃

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-132	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-133	C(O)CF ₃	CH ₂ CF ₃
A-134	C(O)C ₆ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-135	3-metoxyphephenyl	CH ₂ CF ₃
A-136	3-xyanophephenyl	CH ₂ CF ₃
A-137	3-(CO ₂ CH ₂ CH ₃)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-138	3-(C(O)N(CH ₃) ₂)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-139	3-(triflometyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-140	3-(triflometoxy)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-141	3,5-diclophephenyl	CH ₂ CF ₃
A-142	3-flo-5-metyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-143	2-metoxy-5(triflometyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-144	3-clo-5(triflometyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-145	3-(2-clo-4-(triflometyl)phephenyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-146	3-(2-clo-4-(triflometyl)phephenyl)-4-flophephenyl	CH ₂ CF ₃
A-147	3-(2-clo-4-(triflometyl)phephenyl)-5-metyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-148	3-phenyl)phephenyl	CH ₂ CF ₃
A-149	4-metoxyphephenyl	CH ₂ CF ₃

Số thứ tự	ZR ²	R ¹
A-150	3-(3-clo-5-triflometyl-pyridin-2-yl)phenyl	CH ₂ CF ₃

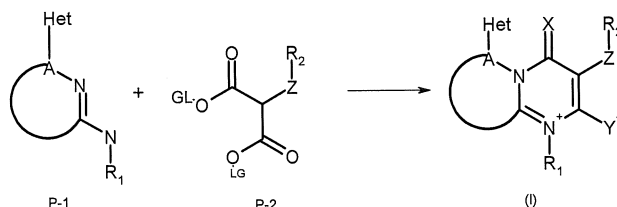
Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được điều chế theo con đường tổng hợp sau, ví dụ theo phương pháp điều chế và sơ đồ điều chế như được mô tả dưới đây.

Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được điều chế ví dụ theo phương pháp điều chế và sơ đồ điều chế như được mô tả dưới đây.

Hợp chất được dùng làm nguyên liệu ban đầu cho quá trình tổng hợp của hợp chất theo sáng chế nhìn chung có thể được điều chế bằng phương pháp tiêu chuẩn của hóa hữu cơ. Nếu không được chỉ rõ theo cách khác, định nghĩa của các biến như X, Y, Het, R¹ và R² của các cấu trúc cho trong sơ đồ có nghĩa giống như được xác định ở trên.

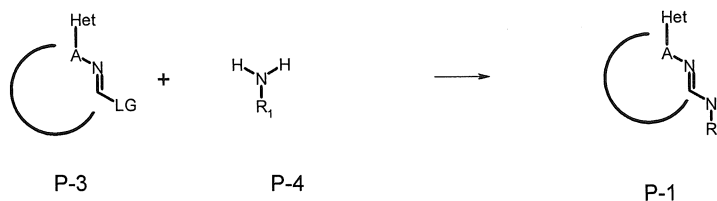
Hợp chất có công thức (I) có thể ví dụ được điều chế bằng cho hợp chất được thể thích hợp P-1 phản ứng với dẫn xuất malonat P-2 giống với phương pháp được mô tả bởi Holyoke và đồng tác giả trong WO 2009/099929 (Sơ đồ 1):

Sơ đồ 1



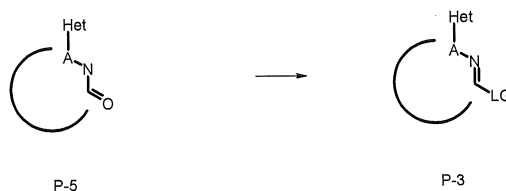
Hợp chất tương tự P-1 có thể được điều chế từ hợp chất tương ứng P-3, bằng cách cho nó phản ứng với amin nucleophil tương tự P-4 như được mô tả bởi, ví dụ, Michel Langlois et al, Journal of Heterocyclic Chemistry, 19(1), 193-200; 1982, trong đó LG dùng để chỉ nhóm rời chuyển như halogen (ví dụ clo hoặc brom), OR', hoặc SR', với R' là C₁-C₆-alkyl, tốt hơn là clo metoxy etoxy, methylthio hoặc etylthio (Sơ đồ 2):

Sơ đồ 2



Hợp chất tương tự P-3 có sẵn từ lactam tương ứng P-5 bằng các phương pháp tiêu chuẩn đã được người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực biết đến. Ví dụ xem Allen, Jennifer Rebecca et al in WO 2004/094382 hoặc Lang, Kai et al, Journal của Organic Chemistry, 75(19), 6424-6435; 2010 (Sơ đồ 3):

Sơ đồ 3



Lactam phổ biến trong hóa hữu cơ và phương pháp để sản xuất chúng đã được biết đến. Ví dụ xem: Smith, M. B. in Science of Synthesis, (2005) 21, 653.

Nếu các hợp chất riêng rẽ không thể được điều chế qua con đường được mô tả ở trên, chúng có thể được điều chế bằng dẫn xuất của các hợp chất có công thức (I) khác hoặc bằng các biến thể thông thường của con đường tổng hợp đã nêu.

Ví dụ, trong các trường hợp riêng, một số hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế thuận lợi từ hợp chất có công thức (I) khác bằng cách tạo dẫn xuất, ví dụ bằng sự thủy phân este, amit hóa, este hóa, sự phân tách ete, olefin hóa, khử, oxy hóa và tương tự, hoặc bằng các biến thể thông thường của con đường tổng hợp đã nêu.

Hỗn hợp phản ứng được xử lý theo cách thông thường, ví dụ bằng cách trộn với nước, tách các pha, và, nếu thích hợp, tinh chế các sản phẩm thô bằng sắc ký, ví dụ trên nhôm ôxit hoặc silicagen.

Thuật ngữ "loài gây hại không xương sống" như được dùng trong bản mô tả này bao gồm quần thể động vật, như động vật chân đốt gây hại, bao gồm các côn trùng và động vật thuộc lớp nhện, cũng như giun tròn, có thể tấn công thực vật từ đó gây tổn

thương đáng kể cho thực vật bị tấn công, cũng như ngoại ký sinh trùng có thể xâm nhiễm động vật, cụ thể là các động vật máu nóng như ví dụ động vật có vú hoặc các loài chim, hoặc động vật bậc cao hơn khác như loài bò sát, động vật lưỡng cư hoặc cá, từ đó gây tổn thương đáng kể cho động vật bị xâm nhiễm.

Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế cụ thể là thích hợp để phòng trừ có hiệu quả động vật chân đốt gây hại như động vật thuộc lớp nhện, động vật nhiều chân và các côn trùng như giun tròn.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt thích hợp để chống lại có hiệu quả các loài gây hại sau:

Các côn trùng từ loại sâu bọ cánh phấn (sâu bọ cánh vảy), ví dụ *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia deláia*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia* bao gồmns, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* và *Zeiraphera canadensis*;

bọ cánh cứng (lớp cánh cứng), ví dụ *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Aphthona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria*

linearis, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera ssp.*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* và *Sitophilus granaria*;

ruồi, muỗi (lớp côn trùng hai cánh), ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium*

mixtum, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* spp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, và *Tipula paludosa*;

bọ trĩ (lớp cánh viền), ví dụ *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* và *Thrips tabaci*,

môi mọt (môi), ví dụ *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes grassei*, *Termes natalensis*, và *Coptotermes formosanus*;

gián (họ *Blattaria* - *Blattodea*), ví dụ *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, và *Blatta orientalis*;

rệp, bọ chết, rầy, bọ cánh phấn, rệp vảy, ve sầu (lớp cánh nửa), ví dụ *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis câyaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*,

Rhopalosiphum insertum, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii*and, *Viteus vitifolii*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., và *Arilus critatus*;

kiến, ong, ong bắp cày, ong cắn lá (lớp cánh màng), ví dụ *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius niger*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, và *Linepithema humile*;

đế, cào cào, châu chấu (lớp cánh thẳng), ví dụ *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Vì tríta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, và *Locustana pardalina*;

màng nhện, như động vật thuộc lớp nhện (nhóm tiết túc), ví dụ thuộc các họ ve mềm, ve cứng và họ Sarcoptidae, như *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Ambryomma maculatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes rixinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, và Eriophyidae spp. như *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* và Eriophyes sheldoni; Tarsonemidae spp. như *Phytonemus pallidus* và *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae spp. như

Brevipalpus phoenicis; Tetranychidae spp. như *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* và *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, và *Oligonychus pratensis*; Araneida, ví dụ *Latrodectus mactans*, và *Loxosceles reclusa*;

bọ chết (họ Siphonaptera), ví dụ bọ chết mèo, bọ chết chó, bọ chết chuột, bọ chết người, bọ jigger, và bọ chết chuột châu Âu,

nhậy, bọ cháy - firebrat (bộ ba đuôi), ví dụ *Lepisma saccharina* và *Thermobia domestica*,

rết (lớp chân môi), ví dụ rết nhà,

động vật nhiều chân (lớp chân kép), ví dụ *Narceus* spp.,

Sâu tai (lớp cánh da), ví dụ bộ đuôi kim,

rận (chấy), ví dụ *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* và *Solenopotes capillatus*.

Collembola (họ bộ đuôi bật - springtails), ví dụ *Onychiurus* spp..

Hợp chất có công thức (I) cũng thích hợp để phòng trừ giun tròn: giun tròn ký sinh cây như tuyến trùng sần rễ, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, và các loài *Meloidogyn* khác; tuyến trùng hình thành bào nang, *Globodera rostochiensis* và các loài *Globodera* khác; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, và các loài *Heterodera* khác; tuyến trùng túi mật hạt giống, các loài *Anguina*; tuyến trùng trên gốc và lá, các loài *Aphelenchoides*; tuyến trùng chích, *Belonolaimus longicaudatus* và các loài *Belonolaimus* khác; tuyến trùng hại thông, *Bursaphelenchus xylophilus* và các loài *Bursaphelenchus* khác; tuyến trùng vòng, loài *Criconema*, loài *Criconemella*, loài *Criconemoides*, loài *Mesocriconema*; giun tròn gốc và bóng, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* và các loài *Ditylenchus* khác; tuyến trùng dùi, loài *Dolichodorus*; giun tròn xoắn ốc, *Helicotylenchus multicinctus* và các loài *Helicotylenchus* khác; tuyến trùng vỏ và sheathoit, loài *Hemicycliophora* và loài *Hemicriconemoides*; loài *Hirshmanniella*; tuyến trùng giáo, loài *Hoploaimus*; tuyến trùng giả rễ, loài *Nacobbus*;

tuyến trùng kim, *Longidorus elongatus* và các loài *Longidorus* khác; tuyến trùng tổn thương, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* và các loài *Pratylenchus* khác; tuyến trùng đào hang, *Radopholus similis* và các loài *Radopholus* khác; giun tròn hình thận, *Rotylenchus robustus* và các loài *Rotylenchus* khác; loài *Scutellonema*; tuyến trùng rễ mập, *Trichodorus primitivus* và các loài *Trichodorus* khác, loài *Paratrichodorus*; giun tròn làm còi cọc, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* và các loài *Tylenchorhynchus* khác; giun tròn chi cam chanh, loài *Tylenchulus*; tuyến trùng dao, loài *Xiphinema*; và các loài giun tròn ký sinh trên cây khác. Hợp chất có công thức (I) có thể dùng cụ thể là để phòng trừ, hoặc chống lại, hoặc xử lý, hoặc ngăn ngừa hoặc bảo vệ mỗi nhóm riêng rẽ của các loài gây hại đích như được thống kê ở trên cũng như từng tổ hợp của chúng.

Mỗi nhóm hoặc nhóm phụ của các loài gây hại được thống kê ở trên, độc lập tạo thành các tổ hợp có thể có của các loài gây hại đích đặc biệt ưu tiên mà hợp chất theo sáng chế hữu hiệu đối với chúng và do đó là phương án cụ thể. Trong ngữ cảnh này, hữu hiệu phải được hiểu là:

dùng để chống lại (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để phòng trừ (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để bảo vệ không bị tấn công bởi (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để xử lý chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để phòng trừ chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để ngăn ngừa chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi (các) loài gây hại này hoặc,

dùng để bảo vệ chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi (các) loài gây hại này.

Hợp chất có công thức (I) có thể dùng cụ thể là để phòng trừ các côn trùng, tốt hơn là các côn trùng xuyên hút như các côn trùng từ các chi cánh ve, côn trùng hai

cánh và cánh nửa.

Hợp chất có công thức (I) có thể dùng cụ thể là để phòng trừ côn trùng của các loại cánh nửa và cánh viên.

Để sử dụng phương pháp theo sáng chế, hợp chất có công thức (I) có thể được biến đổi thành các chế phẩm thông thường, ví dụ dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bụi, bột, hồ bột, hạt và dung dịch có thể phun trực tiếp. Dạng sử dụng phụ thuộc vào mục đích và phương pháp sử dụng cụ thể. Các chế phẩm và phương pháp sử dụng được chọn để đảm bảo trong mỗi trường hợp sự phân phối tốt và đồng đều của hợp chất có công thức (I) theo sáng chế.

Chế phẩm hóa nông theo sáng chế chứa lượng hiệu quả chống lại loài gây hại của hợp chất có công thức (I) theo sáng chế. Thuật ngữ "lượng tác dụng" dùng để chỉ lượng chế phẩm hoặc hợp chất có công thức (I), đủ để phòng trừ động vật gây hại trên một vị trí, như cây trồng, thực vật được trồng hoặc bảo vệ vật liệu và không gây tổn thương đáng kể đối với thực vật được xử lý. Lượng này có thể thay đổi ở phạm vi rộng và phụ thuộc vào các yếu tố khác nhau, như động vật gây hại được phòng trừ, thực vật hoặc vật liệu được trồng được xử lý, điều kiện khí hậu và hợp chất có công thức (I) cụ thể được sử dụng.

Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được biến đổi thành các loại chế phẩm hóa nông thông thường, ví dụ dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bụi, bột, hồ bột, hạt, vật ép, viên nang, và hỗn hợp của chúng. Các ví dụ cho các loại chế phẩm là huyền phù (ví dụ SC, OD, FS), chất cô nhũ hóa được (ví dụ EC), nhũ tương (ví dụ EW, EO, ES, ME), viên nang (ví dụ CS, ZC), hồ bột, viên ngậm, bột hoặc bụi thấm ướt được (ví dụ WP, SP, WS, DP, DS), vật ép (ví dụ BR, TB, DT), hạt (ví dụ WG, SG, GR, FG, GG, MG), sản phẩm có tác dụng chống lại côn trùng (ví dụ LN), cũng như các chế phẩm gel để vật liệu xử lý nhân giống thực vật như hạt giống (ví dụ GF). Các chế phẩm này và các loại chế phẩm khác được xác định trong "Catalogue của pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.

Các chế phẩm được điều chế theo cách đã biết, như được mô tả bởi Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; hoặc Knowles,

New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.

Các ví dụ về chất phù trợ thích hợp cho các chế phẩm và hoặc các chế phẩm hóa nông theo sáng chế là dung môi, chất mang lỏng, chất mang rắn hoặc chất độn, chất hoạt động bề mặt, tác nhân phân tán, chất nhũ hóa, chất thấm ướt, chất bổ trợ, chất làm tan, chất tăng cường thấm qua, chất keo bảo vệ, tác nhân bám dính, chất làm đặc, chất làm ẩm, thuốc xua đuổi, chất hấp dẫn, chất kích thích ăn, chất tương hợp, chất diệt khuẩn, chất chống đông, chất chống tạo bọt, chất tạo màu, chất tăng độ dính và chất liên kết.

Các dung môi và các chất mang lỏng thích hợp là nước và các dung môi hữu cơ, như các phân đoạn dầu khoáng ở điểm sôi trung bình đến cao, ví dụ dầu hỏa, dầu điêzen; dầu có nguồn gốc thực vật hoặc động vật; các hydrocacbon béo, vòng và thơm, ví dụ toluen, parafin, tetrahydronaphtalen, naphtalen được alkyl hóa; rượu, ví dụ etanol, propanol, butanol, benzylrượu, xyclohexanol; các glycol; DMSO; keton, ví dụ xyclohexanon; các este, ví dụ lactat, cacbonat, este axit béo, gammabutyrolacton; axit béo; phosphonat; amin; amit, ví dụ N-metylpyrrolidon, dimetylamit axit béo; và hỗn hợp của chúng.

Các chất mang rắn hoặc chất độn thích hợp là đất khoáng, ví dụ silicat, silicagen, đá tan, cao lanh, đá vôi, vôi, đá phấn, đất sét, dolomit, đất chứa tảo silic, bentonit, canxi sulfat, magie sulfat, magie oxit; bột polysacarit, ví dụ xenluloza, tinh bột; phân bón, ví dụ amoni sulfat, amoni phosphat, amoni nitrat, ure; sản phẩm có nguồn gốc thực vật, ví dụ bột ngũ cốc, bột vỏ cây, bột gỗ, bột vỏ quả hạch, và hỗn hợp của chúng.

Chất hoạt động bề mặt thích hợp là hợp chất hoạt động bề mặt, như các chất hoạt động bề mặt anion, cation, không điện ly và lưỡng tính, polyme khối, chất điện ly trùng hợp, và hỗn hợp của chúng. Các chất hoạt động bề mặt này có thể được dùng làm chất nhũ hóa, tác nhân phân tán, chất làm tan, chất thấm ướt, chất tăng cường thấm qua, keo bảo vệ, hoặc chất phụ trợ. Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt được thông kê trong McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. hoặc North American Ed.).

Các chất hoạt động bề mặt anion thích hợp là kiềm, đất kiềm hoặc muối amoni của sulfonat, sulfat, phosphat, carboxyl, và hỗn hợp của chúng. Các ví dụ về sulfonat là

alkylarylsulfonat, diphenylsulfonat, alpha-olefin sulfonat, lignine sulfonat, sulfonat của axit béo và dầu, sulfonat của alkylphenol được etoxy hóa, sulfonat của arylphenol được alkoxyl hóa, sulfonat của naphthalen được ngưng tụ, sulfonat của dodexyl và tridecylbenzen, sulfonat của naphthalen và alkylnaphtalen, sulfosuccinat hoặc sulfosuccinamat. Các ví dụ về sulfat là sulfat của axit béo và dầu, của alkylphenol được etoxy hóa, của rượu, của rượu được etoxy hóa, hoặc của este axit béo. Các ví dụ về phosphat là este phosphat. Các ví dụ về carboxyl là alkyl carboxyl, và rượu được carboxyl hóa hoặc alkylphenol etoxylat.

Các chất hoạt động bề mặt không điện ly thích hợp là alkoxylat, amit axit béo được thế N, oxit amin, este, chất hoạt động bề mặt gốc đường, chất hoạt động bề mặt polyme, và hỗn hợp của chúng. Các ví dụ về alkoxylat là hợp chất như rượu, alkylphenol, amin, amit, arylphenol, axit béo hoặc este của axit béo được alkoxyl hóa bằng 1 tới 50 đương lượng. Etylen oxit và/hoặc propylen oxit có thể được dùng để alkoxyl hóa, tốt hơn là etylen oxit. Các ví dụ về amit axit béo được thế N là glucamit axit béo hoặc alkanolamit axit béo. Các ví dụ về este là este của axit béo, este glycerol hoặc monoglycerit. Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt gốc đường là sorbitan, sorbitan được etoxy hóa, este sucroza và glucoza hoặc alkylpolyglucosit. Các ví dụ về chất hoạt động bề mặt polyme là homo- hoặc copolyme của vinylpyrrolidon, rượu vinyl, hoặc vinylaxetat.

Các chất hoạt động bề mặt cation thích hợp là chất hoạt động bề mặt bậc bốn, ví dụ hợp chất amoni bậc bốn có một hoặc hai nhóm kỵ nước, hoặc muối của amin sơ cấp mạch dài. Các chất hoạt động bề mặt lưỡng tính thích hợp là alkylbetain và imidazolin. Polyme khối thích hợp là polyme khối của loại A-B hoặc A-B-A chứa các khối polyetylen oxit và polypropylen oxit, hoặc loại A-B-C chứa alkanol, polyetylen oxit và polypropylen oxit. Chất điện ly trung hợp thích hợp là polyaxit hoặc polybazơ. Các ví dụ về polyaxit là muối kiềm của các polyme axit polyacrylic hoặc đĩnh polyaxit. Các ví dụ về polybazơ là polyvinylamin hoặc polyetylenamin.

Chất hỗ trợ thích hợp là hợp chất, có hoạt tính diệt loài gây hại không đáng kể hoặc thậm chí bản thân chúng không có hoạt tính chống lại loài gây hại, và cải thiện đặc tính sinh học của hợp chất có công thức (I) trên đích. Các ví dụ là chất hoạt động bề mặt, dầu khoáng hoặc thực vật, và chất phụ trợ khác. Các ví dụ khác được thống kê bởi

Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Chất làm đặc thích hợp là polysacarit (ví dụ xanthan gum, cacboxymethylxenluloza), đất sét vô cơ (được điều biến hoặc không được điều biến hữu cơ), polycarboxyl, và silicat.

Chất diệt khuẩn thích hợp là các dẫn xuất bronopol và isothiazolinon như alkylisothiazolinon và benzisothiazolinon.

Chất chống đông thích hợp là etylen glycol, propylen glycol, ure và glyxerin.

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

Chất tạo màu thích hợp (ví dụ đỏ, xanh lam, hoặc xanh lục) là các sắc tố của thuốc nhuộm có độ hòa tan trong nước thấp và hòa tan được nước. Các ví dụ là chất tạo màu vô cơ (ví dụ sắt oxit, titan oxit, sắt hexaxyanoferrat) và chất tạo màu hữu cơ (ví dụ chất tạo màu alizarin-, azo- và phthalocyanin).

Chất tăng độ dính hoặc chất liên kết thích hợp là polyvinylpyrrolidon, polyvinylaxetat, rượu polyvinyl, polyacrylat, sáp sinh học hoặc tổng hợp, và ete xenluloza.

Các ví dụ về các loại chế phẩm và phương pháp điều chế chúng là:

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

10-60% trọng lượng là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế và 5-15% khối lượng là chất làm ướt (ví dụ rượu alkoxylat) được hòa tan trong nước và/hoặc trong dung môi hòa tan trong nước (ví dụ rượu) lên tới 100% khối lượng. Chất hoạt động hòa tan vào dung dịch loãng bằng nước.

ii) Chất cô đặc có thể phân tán (dispersible concentrate - DC)

5-25% khối lượng là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế và 1-10% khối lượng là tác nhân phân tán (ví dụ polyvinylpyrrolidon) được hòa tan lên tới 100% khối lượng bằng dung môi hữu cơ (ví dụ xyclohexanon). Pha loãng bằng nước tạo ra thể phân tán.

iii) Chất cô đặc có thể nhũ hóa (emulsifiable concentrate - EC)

15-70% khối lượng là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế và 5-10% khối lượng là chất nhũ hóa (ví dụ canxi dodexylbenzenesulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan lên tới 100% khối lượng bằng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm). Pha loãng bằng nước tạo ra nhũ tương.

iv) Nhũ tương (EW, EO, ES)

5-40% khối lượng là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế và 1-10% khối lượng chất nhũ hóa (ví dụ canxi dodexylbenzenesulfonat và etoxylat dầu thầu dầu) được hòa tan trong 20-40% khối lượng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm). Hỗn hợp này được đưa nước vào để đạt tới 100% khối lượng bằng máy tạo nhũ tương và tạo thành nhũ tương đồng nhất. Pha loãng bằng nước tạo ra nhũ tương.

v) Huyền phù (SC, OD, FS)

Trong máy nghiền bi có khuấy, 20-60% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền nhỏ cùng bổ sung 2-10% khối lượng tác nhân phân tán và chất làm ướt (ví dụ natri lignosulfonat và rượu etoxylat), 0,1-2% khối lượng chất cô đặc (ví dụ gôm xanthan) và bổ sung nước để đạt tới 100% khối lượng để thu được huyền phù chứa hoạt chất mịn. Pha loãng bằng nước tạo ra huyền phù ổn định chứa hoạt chất. Với chế phẩm loại FS lên tới 40% khối lượng chất liên kết (ví dụ rượu polyvinyl) được bổ sung.

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

50-80% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền mịn cùng với việc bổ sung tác nhân phân tán và chất làm ướt (ví dụ natri lignosulfonat và rượu etoxylat) để đạt tới 100% khối lượng và được điều chế ở dạng hạt có thể phân tán trong nước hoặc có thể hòa tan trong nước bằng các thiết bị kỹ thuật (ví dụ ép đùn, tháp phun, kiểu tầng sôi). Pha loãng bằng nước tạo ra thể phân tán hoặc dung dịch ổn định của hoạt chất.

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

50-80% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền

trong máy nghiền động cơ stato cùng với việc bổ sung 1-5% khối lượng tác nhân phân tán (ví dụ natri lignosulfonat), 1-3% khối lượng chất làm ướt (ví dụ rượu etoxylat) và bổ sung chất mang rắn, ví dụ silicagen lên tới 100% khối lượng. Pha loãng bằng nước tạo ra thể phân tán hoặc dung dịch ổn định của hoạt chất.

viii) Gel (GW, GF)

Trong máy nghiền bi có khuấy, 5-25% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền cùng với việc bổ sung 3-10% khối lượng tác nhân phân tán (ví dụ natri lignosulfonat), 1-5% khối lượng chất cô đặc (ví dụ cacboxymethylxenluloza) và bổ sung nước lên tới 100% khối lượng để tạo ra huyền phù mịn chứa hoạt chất. Pha loãng bằng nước tạo ra huyền phù ổn định chứa hoạt chất.

iv) Vi nhũ tương (ME)

5-20% khối lượng là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được bổ sung 5-30% khối lượng là hỗn hợp dung môi hữu cơ (ví dụ axit béo dimethylamit và xyclohexanon), 10-25% khối lượng là hỗn hợp chất hoạt động bề mặt (ví dụ alcohol etoxylat và arylphenol etoxylat), và bổ sung nước lên tới 100% khối lượng. Hỗn hợp này được khuấy trong 1 giờ để tự sinh ra vi nhũ tương ổn định về nhiệt động học.

iv) Vi nang (CS)

Pha dầu chứa 5-50% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế, 0-40% khối lượng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm), 2-15% khối lượng monome acrylic (ví dụ metylmethacrylat, axit metacrylic và di- hoặc triacrylat) được phân tán vào dung dịch nước của keo bảo vệ (ví dụ rượu polyvinyl). Phản ứng trùng hợp gốc được khơi mào bởi chất khơi mào gốc dẫn đến sự hình thành vi nang poly(met)acrylat. Ngoài ra, pha dầu chứa 5-50% khối lượng hợp chất I theo sáng chế, 0-40% khối lượng dung môi hữu cơ không tan trong nước (ví dụ hydrocacbon thơm), và monome isoxyanat (ví dụ diphenylmeten-4,4'-diisoxyanat) được phân tán vào dung dịch nước của keo bảo vệ (ví dụ rượu polyvinyl). Việc bổ sung polyamin (ví dụ hexametylenediamin) dẫn đến sự hình thành vi nang polyure. Lượng monome là 1-10% khối lượng. %

khối lượng tính theo tổng lượng chế phẩm CS.

ix) Bột Dunstable (DP, DS)

1-10% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền mịn và được trộn kỹ với chất mang rắn, ví dụ cao lanh nghiền mịn lên tới 100% khối lượng.

x) Hạt (GR, FG)

0,5-30% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được nghiền mịn và được kết hợp với chất mang rắn (ví dụ silicat) lên tới 100% khối lượng. Sự tạo hạt đạt được bằng cách ép đùn, sấy phun hoặc sấy tầng sôi.

xi) Chất lỏng thể tích cực thấp (UL)

1-50% khối lượng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế được hòa tan trong hữu cơ dung môi, ví dụ hydrocacbon thơm, lên tới 100% khối lượng.

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

Chế phẩm hóa nông nhìn chung chứa hoạt chất nghĩa là hợp chất có công thức (I) theo sáng chế với lượng nằm trong khoảng 0,01 đến 95%, tốt hơn là nằm trong khoảng 0,1 đến 90%, và càng tốt hơn là nằm trong khoảng 0,5 đến 75% khối lượng. Hoạt chất được dùng nhìn chung có độ tinh khiết từ 90% tới 100%, tốt hơn là từ 95% tới 100% (theo phổ NMR).

Chất cô đặc hòa tan trong nước (LS), nhũ huyền phù (SE), chất cô đặc chảy được (FS), bột để xử lý khô (DS), bột có thể phân tán trong nước để xử lý huyền phù (WS), bột hòa tan trong nước (SS), nhũ tương (ES), chất cô đặc nhũ hóa được (EC) và gel (GF) thông thường được dùng cho mục đích xử lý vật liệu nhân giống thực vật, cụ thể là hạt giống.

Các chế phẩm theo sáng chế đã nêu tạo ra, sau khi pha loãng từ hai tới mười lần, nồng độ hoạt chất từ 0,01 tới 60% khối lượng, tốt hơn là từ 0,1 tới 40% khối lượng, trong chế phẩm có sẵn để sử dụng.

Việc sử dụng có thể được thực hiện trước hoặc trong khi gieo hạt. Phương pháp đưa hoặc xử lý hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của chúng, tương ứng, lên vật liệu nhân giống thực vật, đặc biệt là hạt giống bao gồm tạo áo, phủ, tạo hạt, rây, ngâm và dung trong rãnh của vật liệu nhân giống. Tốt hơn là, hợp chất có công thức (I) hoặc các chế phẩm của chúng, tương ứng, được đưa lên vật liệu nhân giống thực vật bằng phương pháp sao cho sự nảy mầm không được tạo ra, ví dụ bằng cách tạo áo hạt giống, tạo hạt, phủ và rây hạt giống.

Khi được dùng để bảo vệ thực vật, lượng chất hoạt động được dùng, phụ thuộc vào kiểu tác dụng mong muốn, là từ 0,001 đến 2 kg trên một hecta, tốt hơn là từ 0,005 đến 2 kg trên một hecta, càng tốt hơn là từ 0,05 đến 0,9 kg trên một hecta, cụ thể là từ 0,1 đến 0,75 kg trên một hecta.

Để xử lý vật liệu nhân giống thực vật như hạt giống, ví dụ bằng cách rây, phủ hoặc ngâm hạt giống, nhìn chung đòi hỏi lượng hợp chất từ 0,1 đến 1000 g, tốt hơn là từ 1 đến 1000 g, càng tốt hơn là từ 1 đến 100 g và tốt hơn nữa là từ 5 đến 100 g, tính theo 100 kilogam vật liệu nhân giống thực vật (tốt hơn là hạt giống).

Khi dùng để bảo vệ vật liệu hoặc sản phẩm được lưu giữ, lượng hoạt chất được sử dụng phụ thuộc vào loại diện tích ứng dụng và hiệu quả mong muốn. Lượng thông thường được dùng để bảo vệ vật liệu là 0,001 g đến 2 kg, tốt hơn là 0,005 g đến 1 kg, hoạt chất trên một mét khối vật liệu xử lý.

Các loại dầu, chất thấm ướt, chất hỗ trợ, phân bón, hoặc vi chất dinh dưỡng khác nhau, và thuốc chống lại loài gây hại khác (ví dụ thuốc diệt cỏ, thuốc trừ sâu, thuốc trừ nấm, chất điều hòa sinh trưởng, chất an toàn) có thể được bổ sung vào chất hoạt động hoặc các chế phẩm chứa chúng như hỗn hợp trộn trước hoặc, nếu thích hợp mãi cho đến ngay trước khi sử dụng (trộn tại thùng). Các tác nhân này có thể được trộn với các chế phẩm theo sáng chế với tỷ lệ khối lượng là 1:100 tới 100:1, tốt hơn là 1:10 tới 10:1.

Người sử dụng thường dùng chế phẩm theo sáng chế từ thiết bị định sẵn liều lượng, bình phun đeo trên lưng, thùng phun, máy bay dùng để phun, hoặc hệ thống tưới. Thông thường, chế phẩm hóa nông được xử lý với nước, chất đệm, và/hoặc chất phụ trợ khác đến nồng độ sử dụng mong muốn và vì vậy thu được dung dịch phun có sẵn để sử dụng hoặc chế phẩm hóa nông theo sáng chế. Thông thường, 20 tới 2000 lít, tốt hơn là

50 tới 400 lít, dung dịch phun có sẵn để sử dụng được dùng trên một hecta diện tích hữu dụng trong nông nghiệp.

Theo một phương án thực hiện sáng chế, các thành phần riêng rẽ của chế phẩm theo sáng chế như các phần của bộ kit hoặc các phần của hỗn hợp hai thành phần hoặc ba thành phần có thể được trộn lẫn bởi chính người sử dụng trong thùng phun và chất phụ trợ khác có thể được bổ sung, nếu thích hợp.

Theo phương án khác, hoặc là các thành phần riêng rẽ của chế phẩm theo sáng chế hoặc các thành phần được trộn trước một phần, ví dụ các thành phần chứa hợp chất có công thức (I) và/hoặc hoạt chất khác từ các nhóm M.1) đến M.26, bao gồm M-X hoặc F.I đến F.XII, có thể được trộn lẫn bởi người sử dụng trong thùng phun và các chất phụ trợ và chất bổ trợ khác có thể được bổ sung, nếu thích hợp.

Theo phương án khác, hoặc là các thành phần riêng rẽ của chế phẩm theo sáng chế hoặc các thành phần được trộn trước một phần, ví dụ các thành phần chứa hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất hoạt động từ các nhóm M.1 đến M.26, bao gồm M-X hoặc F.I đến F.XII, có thể được dùng cùng nhau (ví dụ sau khi trộn trong thùng) hoặc nối tiếp.

Hỗn hợp

Danh sách M sau của thuốc diệt loài gây hại, được tạo nhóm và được đánh số theo Mode of Action Classification của Insecticide Resistance Action Committee (IRAC), cùng với hợp chất theo sáng chế có thể được dùng và với hiệu quả hỗ trợ tiềm năng có thể được tạo ra, được dự định để minh họa các tổ hợp có thể có, nhưng không giới hạn ở:

M.1 Chất ức chế axetylcholin esterase (AChE) từ lớp

M.1A cacbamat, ví dụ aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocacboxim, butoxycacboxim, carbaryl, cacbofuran, cacbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylylcarb và triazamat; hoặc từ lớp

M.1B organophosphat, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphosmethyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos,

chlorpyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicotophos, dimethoate, dimetylviphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothio-phosphoryl) salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos- metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon và vamidothion;

M.2. Chất đối kháng kênh clorua tạo khung GABA như:

M.2A hợp chất xyclodien organoclo, ví dụ như endosulfan hoặc clodan; hoặc

M.2B fiprole (phenylpyrazol), ví dụ như ethiprol, fipronil, flufiprole, pyrafluprole và pyriprole;

M.3 Chất điều biến kênh natri từ lớp

M.3A pyrethroid, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-cyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenethrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, heptafluthrin, imiprothrin, meperfluthrin, metofluthrin, momfluorothrin, permethrin, phenothrin, prallethrin, profluthrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetrametylfluthrin, tetramethrin, tralomethrin và transfluthrin; hoặc

M.3B chất điều biến kênh natri như DDT hoặc metoxychlor;

M.4 Chất chủ vận thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR) từ lớp

M.4A neonicotinoid, ví dụ acteamiprid, chlothianidin, xycloxaprid, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiachloprid và thiamethoxam; hoặc hợp chất

M.4A.2:(2E)-1-[(6-Clopyridin-3-yl)metyl]-N'-nitro-2-

pentylidenhydrazincacboximidamit; hoặc

M4.A.3: 1-[(6-Clopyridin-3-yl)metyl]-7-metyl-8-nitro-5-propoxy-1,2,3,5,6,7-hexahydroimidazo[1,2-a]pyridin;

hoặc từ lớp M.4B nicotin;

M.5 Chất hoạt hóa biến cấu thụ thể nicotinic axetylcholin từ lớp spinosyn,

ví dụ spinosad hoặc spinetoram;

M.6 Chất hoạt hóa kênh clorua từ lớp avermectin và milbemycin, ví dụ abamectin, emamectin benzoat, ivermectin, lepimectin hoặc milbemectin;

M.7 Chất bắt chước hormon kích sâu non, như

M.7A chất tương tự hormon kích sâu non như hydropren, kinopren và methopren; hoặc các chất khác như M.7B fenoxycarb hoặc M.7C pyriproxyfen;

M.8 chất ức chế hỗn tạp không đặc hiệu (đa vị trí), ví dụ

M.8A alkyl halogenua như metyl bromua và các alkyl halogenua khác, hoặc

M.8B clopicrin, hoặc M.8C sulfuryl florua, hoặc M.8D borac, hoặc M.8E tartar emetic;

M.9 Tác nhân ngăn không cho côn trùng cánh giống chọn lọc ăn, ví dụ

M.9B pymetrozin, hoặc M.9C flonicamid;

M.10 Chất ức chế sinh trưởng của nhện, ví dụ

M.10A clofentezin, hexythiazox và diflovidazin, hoặc M.10B etoxazol;

M.11 Chất phá vỡ hệ vi sinh vật của màng dạ dày côn trùng, ví dụ *bacillus thuringiensis* hoặc *bacillus sphaericus* và protein trừ sâu mà chúng tạo ra như *bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* và *bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, hoặc protein cây Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb và Cry34/35Ab1;

M.12 Chất ức chế synthaza ATP ty thể, ví dụ

M.12A diafenthiuron, hoặc

M.12B chất diệt ve bét là hợp chất hữu cơ chứa thiếc như azoxyclofen, cyhexatin hoặc fenbutatin oxit, hoặc M.12C propargite, hoặc M.12D tetradifon;

M.13 Không liên kết phosphoryl hóa oxy hóa nhờ sự phá hủy của gradien proton, ví dụ chlorfenapyr, DNOC hoặc sulfluramid;

M.14 Tác nhân ngăn chặn kênh thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR), ví dụ chất tương tự nereistoxin là bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam hoặc natri thiosultap;

M.15 Chất ức chế tổng hợp sinh học chitin loại 0, như benzoylure ví dụ như bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron hoặc triflumuron;

M.16 Chất ức chế tổng hợp sinh học chitin loại 1, ví dụ như buprofezin;

M.17 Chất ngăn cản lột xác, lớp côn trùng hai cánh, ví dụ như cyromazin;

M.18 Chất chủ vận thụ thể ecdyson như diacylhydrazin, ví dụ metoxyfenozit, tebufenozit, halofenozit, fufenozit hoặc chromafenozit;

M.19 Chất chủ vận thụ thể octopamin, ví dụ như amitraz;

M.20 Chất ức chế vận chuyển electron phức chất ty thể III, ví dụ

M.20A hydrametylnon, hoặc M.20B acequinocyl, hoặc M.20C fluacrypyrim;

M.21 Chất ức chế vận chuyển electron phức chất ty thể I, ví dụ

M.21A Thuốc trừ rệp cây và thuốc trừ sâu METI như fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad hoặc tolfenpyrad, hoặc M.21B rotenon;

M.22 Tác nhân ngăn chặn kênh natri phụ thuộc điện áp, ví dụ

M.22A indoxacarb, hoặc M.22B metaflumizon, hoặc M.22B.1: 2-[2-(4-Xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-N-[4-(diflometoxy)phenyl]-hydrazincacboxamit hoặc M.22B.2: N-(3-Clo-2-metylphenyl)-2-[(4-clophenyl)[4-[metyl(metylsulfonyl)amino]phenyl]metylen]-hydrazincacboxamit;

M.23 Chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, như dẫn xuất axit tetronic và tetramic, ví dụ spirodiclofen, spiromesifen hoặc spirotetramat;

M.24 Chất ức chế vận chuyển electron phức chất ty thể IV, ví dụ

M.24A phosphin như nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin hoặc kẽm phosphua, hoặc M.24B xyanua;

M.25 Chất ức chế vận chuyển electron phức chất ty thể II, như dẫn xuất beta-ketonitril, ví dụ xyenopyrafen hoặc xyflumetofen;

M.28 Chất điều biến thụ thể ryanodin từ lớp diamit, ví dụ như flubendiamit, chlorantraniliprole (rynaxypyr®), cyantraniliprole (cyazypyr®), hoặc hợp chất phthalamit

M.28.1: (R)-3-Chlor-N1-{2-metyl-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluormetyl)etyl]phenyl}-N2-(1-metyl-2-metylsulfonyletyl)phthalamid và

M.28.2: (S)-3-Chlor-N1-{2-metyl-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluormetyl)etyl]phenyl}-N2-(1-metyl-2-metylsulfonyletyl)phthalamid, hoặc hợp chất

M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)carbamoyl]phenyl}-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-cacboxamit (tên ISO dự định: cyclaniliprole), hoặc hợp chất

M.28.4: metyl-2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-chlorpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]cacbonyl} amino)benzoyl]-1,2-dimetylhydrazinecacboxylat; hoặc hợp chất được chọn từ M.28.5a) đến M.28.5l):

M.28.5a) N-[4,6-diclo-2-[(dietyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyl]-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5b) N-[4-clo-2-[(dietyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyl]-6-metyl-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5c) N-[4-clo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyl]-6-metyl-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5d) N-[4,6-diclo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyl]-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5e) N-[4,6-diclo-2-[(dietyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyl]-phenyl]-2-

(3-clo-2-pyridyl)-5-(diflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5f) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyle]-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5g) N-[4-clo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyle]-6-xyano-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyle]-phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-cacboxamit;

M.28.5i) N-[2-(5-Amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-cacboxamit;

M.28.5j) 3-Clo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-N-[2,4-diclo-6-[(1-xyano-1-metyletyl)amino]cacbonyl]phenyl]-1H-pyrazol-5-cacboxamit;

M.28.5k) 3-Bromo-N-[2,4-diclo-6-(metylcarbamoyle)phenyl]-1-(3,5-diclo-2-pyridyl)-1H-pyrazol-5-cacboxamit;

M.28.5l) N-[4-Clo-2-[(1,1-dimetyletyl)amino]cacbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-cacboxamit;

hoặc hợp chất được chọn từ

M.28.6: N-(2-xyanopropan-2-yl)-N-(2,4-dimetylphenyl)-3-iodobenzen-1,2-dicacboxamit; hoặc

M.28.7: 3-Clo-N-(2-xyanopropan-2-yl)-N-(2,4-dimetylphenyl)-benzen-1,2-dicacboxamit;

M.28.8a) 1-(3-Clo-2-pyridinyl)-N-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylamino)cacbonyl]phenyl]-3-[[5-(triflometyl)-2H-tetrazol-2-yl]metyl]-1H-pyrazol-5-cacboxamit; hoặc

M.28.8b) 1-(3-Clo-2-pyridinyl)-N-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylamino)cacbonyl]phenyl]-3-[[5-(triflometyl)-1H-tetrazol-1-yl]metyl]-1H-pyrazol-5-cacboxamit;

Hợp chất có hoạt tính chống lại côn trùng M.UN. có cách thức hoạt động chưa được biết hoặc bất định, ví dụ như afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, amidoflumet,

benzoximat, bifenazat, bromopropylat, chinomethionat, cryolit, dicofol, flufenimer, flometoquin, fluensulfon, fluopyram, flupyradifuron, fluralaner, metoxadiazon, piperonyl butoxit, pyflubumid, pyridalyl, pyrifluquinazon, sulfoxaflor, tioazafen, triflumezopyrim, hoặc hợp chất

M.UN.3: 11-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-12-hydroxy-1,4-dioxa-9-azadispiro[4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-on, hoặc hợp chất

M.UN.4: 3-(4'-flo-2,4-dimetylbi-phenyl-3-yl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-on, hoặc hợp chất

M.UN.5: 1-[2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl]-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin, hoặc hoạt động dựa trên cơ sở của *bacillus firmus* (Votivo, I-1582); hoặc hợp chất được chọn từ nhóm M.UN.6, trong đó hợp chất được chọn từ M.UN.6a) đến M.UN.6k):

M.UN.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit;

M.UN.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-5-flo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit;

M.UN.6c) (E/Z)-2,2,2-triflo-N-[1-[(6-flo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]axetamit;

M.UN.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit;

M.UN.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-clo-3-pyridyl)etyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit;

M.UN.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2-diflo-axetamit;

M.UN.6g) (E/Z)-2-clo-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2-diflo-axetamit;

M.UN.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-clopyrimidin-5-yl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit;

M.UN.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,3,3,3-pentaflu-propanamit.);

M.UN.6j) N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflu-thioaxetamit hoặc của hợp chất

M.UN.6k) N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflu-N'-isopropyl-axetamidin

hoặc hợp chất

M.UN.8: 8-clo-N-[2-clo-5-metoxypheyl)sulfonyl]-6-trifluometyl)-imidazo[1,2-a]pyridin-2-cacboxamit; hoặc

M.UN.9: 4-[5-(3,5-diclophenyl)-5-(trifluometyl)-4H-isoxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxothietan-3-yl)benzamit; hoặc

M.UN.10: 5-[3-[2,6-diclo-4-(3,3-dicloallyloxy)phenoxy]propoxy]-1H-pyrazol; hoặc hợp chất được chọn từ nhóm M.UN.11, trong đó hợp chất được chọn từ M.UN.11a) đến M.UN.11p):

M.UN.11.a) 3-[benzoyl(metyl)amino]-N-[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]-2-flu-benzamit;

M.UN.11.b) 3-(benzoylmetylamin)-N-[2-bromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflu-1-(trifluometyl)propyl]-6-(trifluometyl)phenyl]-2-flu-benzamit;

M.UN.11.c) 3-(benzoylmetylamin)-2-flu-N-[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]-benzamit;

M.UN.11.d) N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]amino]cacbonyl]phenyl]-N-metyl-benzamit;

M.UN.11.e) N-[3-[[[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]amino]cacbonyl]-2-fluophenyl]-4-flu-N-metyl-benzamit;

M.UN.11.f) 4-flu-N-[2-flu-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]amino]cacbonyl]phenyl]-N-metyl-benzamit;

M.UN.11.g) 3-flu-N-[2-flu-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflu-1-(trifluometyl)etyl]-6-(trifluometyl)phenyl]amino]cacbonyl]phenyl]-N-metyl-benzamit;

M.UN.11.h) 2-clo-N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]cacbonyl]phenyl]- 3-pyridincacboxamit;

M.UN.11.i) 4-xyano-N-[2-xyano-5-[[2,6-dibromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]phenyl]carbamoyl]phenyl]-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.j) 4-xyano-3-[(4-xyano-2-metyl-benzoyl)amino]-N-[2,6-diclo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]phenyl]-2-flo-benzamit;

M.UN.11.k) N-[5-[[2-clo-6-xyano-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]phenyl]carbamoyl]-2-xyano-phenyl]-4-xyano-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.l) N-[5-[[2-bromo-6-clo-4-[2,2,2-triflo-1-hydroxy-1-(triflometyl)etyl]phenyl]carbamoyl]-2-xyano-phenyl]-4-xyano-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.m) N-[5-[[2-bromo-6-clo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]phenyl]carbamoyl]-2-xyano-phenyl]-4-xyano-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.n) 4-xyano-N-[2-xyano-5-[[2,6-diclo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]phenyl]carbamoyl]phenyl]-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.o) 4-xyano-N-[2-xyano-5-[[2,6-diclo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]carbamoyl]phenyl]-2-metyl-benzamit;

M.UN.11.p) N-[5-[[2-bromo-6-clo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]carbamoyl]-2-xyano-phenyl]-4-xyano-2-metyl-benzamit;

hoặc hợp chất được chọn từ nhóm M.UN.12, trong đó hợp chất được chọn từ M.UN.12a) đến M.UN.12m):

M.UN.12.a) 2-(1,3-Dioxan-2-yl)-6-[2-(3-pyridinyl)-5-thiazolyl]-pyridin;

M.UN.12.b) 2-[6-[2-(5-flo-3-pyridinyl)-5-thiazolyl]-2-pyridinyl]-pyrimidin;

M.UN.12.c) 2-[6-[2-(3-Pyridinyl)-5-thiazolyl]-2-pyridinyl]-pyrimidin;

M.UN.12.d) N-Metylsulfonyl-6-[2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]pyridin-2-cacboxamit

M.UN.12.e) N-Metylsulfonyl-6-[2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]pyridin-2-cacboxamit

M.UN.12.f) N-Etyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.g) N-Metyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.h) N,2-Dimetyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.i) N-Etyl-2-metyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.j) N-[4-Clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-etyl-2-metyl-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.k) N-[4-Clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N,2-dimetyl-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.l) N-[4-Clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-metyl-3-metylthio-propanamit

M.UN.12.m) N-[4-Clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-etyl-3-metylthio-propanamit; hoặc hợp chất

M.UN.13: 2-(4-metoxyminoxyclohexyl)-2-(3,3,3-trifluoropropylsulfonyl)acetonitril;

hoặc hợp chất

M.UN.14a) 1-[(6-Clo-3-pyridinyl)metyl]-1,2,3,5,6,7-hexahydro-5-metoxi-7-metyl-8-nitro-imidazo[1,2-a]pyridine; hoặc

M.UN.14b) 1-[(6-Clopyridin-3-yl)metyl]-7-metyl-8-nitro-1,2,3,5,6,7-hexahydroimidazo[1,2-a]pyridin-5-ol; hoặc hợp chất

M.UN.15: 1-[(2-Clo-1,3-thiazol-5-yl)metyl]-3-(3,5-diclophenyl)-9-metyl-4-oxo-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olat.

Hợp chất có bán trên thị trường của nhóm M nêu trên có thể được tìm thấy trong The Pesticide Manual, 15th Edition, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council

(2011) ngoài các công bố khác.

Neonicotinoid xycloxaprid đã biết từ WO20120/069266 và WO2011/06946, và hợp chất neonicotinoid M.4A.2, đôi khi cũng được gọi là Guadipyr, đã biết từ WO2013/003977, và hợp chất neonicotinoid M.4A.3. (được xem như paichongding ở Trung Quốc) đã biết từ WO2010/069266. Chất tương tự metaflumizon M.22B.1 được mô tả trong CN 10171577 và chất tương tự M.22B.2 trong CN102126994. Cả hai phthalamit M.28.1 và M.28.2 đã biết từ WO 2007/101540. Anthranilamit M.28.3 được mô tả trong WO2005/077934. Hợp chất hydrazit M.28.4 được mô tả trong WO 2007/043677. Các anthranilamit M.28.5a) đến M.28.5h) có thể được điều chế như được mô tả trong WO 2007/006670, WO2013/024009 và WO2013/024010, hợp chất anthranilamit M.28.5i) được mô tả trong WO2011/085575, hợp chất M.28.5j) trong WO2008/134969, hợp chất M.28.5k) trong US2011/046186 và hợp chất M.28.5l) trong WO2012/034403. Hợp chất diamit M.28.6 và M.28.7 có thể được tìm thấy trong CN102613183. Hợp chất anthranilamit M.28.8a) và M.28.8b) đã biết từ WO2010/069502.

Dẫn xuất quinolin flometoquin được thể hiện trong WO2006/013896. Hợp chất aminofuranon flupyradifuron đã biết từ WO 2007/115644. Hợp chất sulfoximin sulfoxaflor đã biết từ WO2007/149134. Từ nhóm pyrethroids momfluorothrin đã biết từ US6908945 và heptafluthrin từ WO10133098. Hợp chất oxadiazolon metoxadiazon có thể được tìm thấy trong JP13/166707. Thuốc trừ rệp cây pyrazol pyflubumit đã biết từ WO2007/020986. Hợp chất isoxazolin được mô tả trong các công bố sau: fluralaner trong WO2005/085216, afoxolaner trong WO2009/002809 và trong WO2011/149749 và hợp chất isoxazolin M.UN.9 trong WO2013/050317. Dẫn xuất pyripyropen afidopyropen được mô tả trong WO 2006/129714. Tioxazafen diệt giun tròn được bộc lộ trong WO09023721 và fluopyram diệt giun tròn trong WO2008126922, hỗn hợp diệt giun tròn chứa flupyram trong WO2010108616. Hợp chất triflumezopyrim được mô tả trong WO2012/092115.

Dẫn xuất ketoenol vòng được thể spiroketal M.UN.3 đã biết từ WO2006/089633 và dẫn xuất ketoenol vòng xoắn được thể biphenyl M.UN.4 từ WO2008/067911. Triazolylphenylsulfat M.UN.5 được mô tả trong WO2006/043635, và tác nhân phòng trừ sinh học dựa trên cơ sở *bacillus firmus* trong WO2009/124707.

Hợp chất M.UN.6a) đến M.UN.6i) được liệt kê dưới M.UN.6 được mô tả trong WO2012/029672 và hợp chất M.UN.6j) và M.UN.6k) trong WO2013129688. Hợp chất diệt giun tròn M.UN.8 trong WO2013/055584 và chất tương tự loại pyridalyl M.UN.10 trong WO2010/060379. Hợp chất cacboxamit M.UN.11.a) đến M.UN.11.h) có thể được điều chế như được mô tả trong WO 2010/018714 và cacboxamit M.UN.11i) đến M.UN.11.p) được mô tả WO2010/127926. Pyridylthiazol M.UN.12.a) đến M.UN.12.c) đã biết từ WO2010/006713, M.UN.12.c) và M.UN.12.d) WO2012000896 và M.UN.12.f) đến M.UN.12.m) trong WO2010129497. Hợp chất malononitril M.UN.13 được mô tả trong WO2009/005110. Hợp chất M.UN.14a) và M.UN.14b) đã biết từ WO2007/101369. Hợp chất M.UN.15 có thể được tìm thấy trong WO 2013/192035.

Danh sách F của chất có hoạt tính diệt nấm sau, kết hợp với hợp chất theo sáng chế có thể được dùng, nhằm mục đích minh họa các tổ hợp có thể có nhưng không giới hạn ở những tổ hợp này:

F.I) Chất ức chế hô hấp

F.I-1) Chất ức chế của phức chất III ở vị trí Qo:

strobilurin: azoxystrobin, coumetoxystrobin, coumoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin, kresoxim-metyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyribencarb, triclopyricarb/clodincarb, trifloxystrobin, 2-[2-(2,5-dimetyl-phenoxy-metyl)-phenyl]-3-metoxi-acrylic axit metyl este và 2 (2-(3-(2,6-diclophenyl)-1-metyl-allylidenaminoxymetyl)-phenyl)-2-metoxiimino-N metyl-axetamit;

oxazolidindion và imidazolinon: famoxadon, fenamidon;

F.I-2) Chất ức chế của phức chất II (ví dụ cacboxamit):

carboxanilit: benodanil, benzovindiflupyr, bixafen, boscalid, cacboxin, fenfuram, fenhexamid, fluopyram, flutolanil, furametpyr, isopyrazam, isotianil, mepronil, oxycacboxin, penflufen, penthiopyrad, sedaxane, tecloftalam, thifluzamit, tiadinil, 2-amino-4 metyl-thiazol-5-cacboxanilid, N-(3',4',5' triflobiphenyl-2 yl)-3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4 cacboxamit (fluxapyroxad), N-(4'-triflometylthiobiphenyl-2-yl)-3-diflometyl-1-metyl-1H pyrazol-4-cacboxamit, N-(2-(1,3,3-trimetyl-butyl)-phenyl)-1,3-dimetyl-5 fluoro-1H-pyrazol-4 cacboxamit, 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-

trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(triflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(triflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(diflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(triflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(triflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 3-(diflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit, 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-cacboxamit;

F.I-3) Chất ức chế của phức chất III ở vị trí Qi: cyazofamid, amisulbrom, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-axetoxy-4-metoxy-pyridin-2-cacbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-(axetoxymetoxy)-4-metoxy-pyridin-2-cacbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-isobutoxycacbonyloxy-4-metoxy-pyridin-2-cacbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, [(3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ylmetoxy)-4-metoxy-pyridin-2-cacbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-metylpropanoat, 3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(3-hydroxy-4-metoxy-2-pyridinyl)cacbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-8-(phenylmetyl)-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat;

F.I-4) Các chất ức chế hô hấp khác (phức chất I, không liên kết) diflumetorim; (5,8-difloquinazolin-4-yl)-{2-[2-flo-4-(4-triflometylpyridin-2-yloxy)-phenyl]-etyl}-amin; tecnazen; ferimzon; ametoctradin; silthiofam; dẫn xuất nitrophenyl: binapacryl, dinobuton, dinocap, fluazinam, nitrthal-isopropyl, và

bao gồm hợp chất organokim loại: muối fentin, như fentin-axetat, fentin clorua hoặc fentin hydroxit;

F.II) Chất ức chế tổng hợp sinh học sterol (thuốc trừ nấm SBI)

F.II-1) Chất ức chế demetylaza C14 (thuốc trừ nấm DMI, ví dụ triazol, imidazol)

triazol: azaconazol, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, paclobutrazole, penconazole, propiconazole, prothioconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole, uniconazole, 1-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol;

imidazol: imazalil, pefurazoate, oxpoconazole, prochloraz, triflumizole;

pyrimidin, pyridin và piperazin: fenarimol, nuarimol, pyrifenox, triforine, 1-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol;

F.II-2) Chất ức chế reductaza Delta14 (Amin, ví dụ morpholin, piperidin)

morpholin: aldimorph, dodemorph, dodemorph-axetat, fenpropimorph, tridemorph;

piperidin: fenpropidin, piperalin; spiroketalamin: spiroxamin;

F.II-3) Chất ức chế 3-keto reductaza: hydroxyanilit: fenhexamid;

F.III) Chất ức chế tổng hợp axit nucleic

F.III-1) Tổng hợp ARN, ADN

thuốc trừ nấm phenylamit hoặc axit amin axyl: benalaxyl, benalaxyl-M, kiralaxyl, kim loạiaxyl, kim loạiaxyl-M (mefenoxam), ofurace, oxadixyl;

isoxazol và iosothiazolon: hymexazol, octhilinon;

F.III-2) Chất ức chế topisomeraza ADN: axit oxolinic;

F.III-3) Sự trao đổi chất nucleotit (ví dụ adenosin-deaminaza), hydroxy (2-amino)-pyrimidin: bupirimat;

F.IV) Chất ức chế phân chia tế bào và hoặc cytoskeleton

F.IV-1) Chất ức chế tubulin: benzimidazol và thiophanat: benomyl, carbendazim,

fuberidazole, thiabendazole, thiophanate-methyl;

triazolopyrimidin: 5-clo-7 (4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5 a]pyrimidin;

F.IV-2) Các chất ức chế phân chia tế bào khác

benzamidit và phenyl axetamidit: diethofencarb, ethaboxam, pencycuron, fluopicolide, zoxamidit;

F.IV-3) Chất ức chế actin: benzophenon: metrafenon, pyriofenon;

F.V) Chất ức chế tổng hợp axit amin và protein

F.V-1) Chất ức chế tổng hợp methionin (anilino-pyrimidin)

anilino-pyrimidin: cyprodinil, mepanipyrin, nitrapyrin, pyrimethanil;

F.V-2) Chất ức chế tổng hợp protein (anilino-pyrimidin)

thuốc kháng sinh: blasticidin-S, kasugamycin, kasugamycin hydroclorua-hydrate, mildiomicin, streptomycin, oxytetracyclin, polyoxin, validamycin A;

F.VI) Chất ức chế dẫn truyền tín hiệu

F.VI-1) Chất ức chế MAP / Histidin kinaza (ví dụ anilino-pyrimidin)

dicacboximit: fluoroimid, iprodione, procymidone, vinclozolin;

phenylpyrrol: fenpiclonil, fludioxonil;

F.VI-2) Chất ức chế protein G: quinolin: quinoxifen;

F.VII) Chất ức chế tổng hợp lipid và màng

F.VII-1) Chất ức chế tổng hợp sinh học phospholipit

hợp chất phospho hữu cơ: edifenphos, iprobenfos, pyrazophos;

dithiolan: isoprothiolan;

F.VII-2) Peroxi hóa chất béo: các hydrocacbon thơm: dicloran, quintozone, tecnazene, tolclofos-methyl, biphenyl, cloneb, etridiazol;

F.VII-3) Amit của axit cacboxyl (thuốc trừ nấm CAA)

amit của axit xianamic hoặc mandelic: dimethomorph, flumorph, mandiproamid,

pyrimorph;

valinamit cacbamat: benthiavalicarb, iprovalicarb, pyribencarb, valifenalate và (4-flophenyl) este của axit N-(1-(1-(4-xyano-phenyl)ethanesulfonyl)-but-2-yl) carbamic ;

F.VII-4) Hợp chất ảnh hưởng tính thấm thấu màng tế bào và axit béo:

1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, cacbamat: propamocarb, propamocarb-hydrochlorid;

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

F.VIII) Chất ức chế với tác động đa vị trí

F.VIII-1) Các chất hoạt động vô cơ: hỗn hợp Bordeaux, đồng axetat, đồng hydroxit, đồng oxyclorea, bazơ đồng sulfat, lưu huỳnh;

F.VIII-2) Thio- và dithiocacbamat: ferbam, mancozeb, maneb, metam, methasulphocarb, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram;

F.VIII-3) Hợp chất organoclo (ví dụ phthalimit, sulfamit, clonitritl):

anilazin, clothalonil, captafol, captan, folpet, dichlofluanid, diclophen, flusulfamit, hexaclobenzene, pentachlorophenole và muối của nó, phthalide, tolylfluanid, N-(4-clo-2-nitro-phenyl)-N-etyl-4-metyl-benzensulfonamit;

F.VIII-4) Guanidin và các chất khác: guanidin, dodin, dodin không bazơ, guazatin, guazatine-axetat, iminoctadin, iminoctadine-triaxetat, iminoctadine-tris(albesilat), 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrole-1,3,5,7(2H,6H)-tetraon;

F.VIII-5) Ahtraquinon: dithianon;

F.IX) Chất ức chế tổng hợp thành tế bào

F.IX-1) Chất ức chế tổng hợp glucan: validamycin, polyoxin B;

F.IX-2) Chất ức chế tổng hợp melanin: pyroquilon, tricyclazole, carpropamit,

dixyclomet, fenoxanil;

F.X) Thuốc gây cảm ứng phòng vệ ở cây

F.X-1) Lộ trình axit salixylic: acibenzolar-S-metyl;

F.X-2) Các chất khác: probenazol, isotianil, tiadinil, prohexadion-canxi;

phosphonat: fosetyl, fosetyl-nhôm, axit phosphorơ và muối của nó;

F.XI) Phương thức hoạt động chưa biết: bronopol, chinomethionat, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, difenzoquat, difenzoquat-metylsulfat, diphenylamin, fenpyrazamin, flumetover, flusulfamid, flutianil, methasulfocarb, nitrapyrin, nitrothal-isopropyl, oxathiapiprolin, oxin-đồng, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazoxit, 2-butoxy-6-iodo-3-propylchromen-4-one, N-(xyclopropylmethoxyimino-(6-diflo-methoxy-2,3-diflo-phenyl)-metyl)-2-phenyl axetamid, N'-(4-(4-clo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N metyl formamidine, N' (4-(4-flo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidine, N'-(2-metyl-5-triflometyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, N'-(5-diflometyl-2-metyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin, metyl-(1,2,3,4-tetrahydro-naphthalen-1-yl)-amid của axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-cacboxylic, metyl-(R)-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalen-1-yl-amit của axit 2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-thiazol-4-cacboxylic, 6-tert-butyl-8-flo-2,3-dimetyl-quinolin-4-yl este của axit methoxy-axetic và N-Metyl-2-{1-[2-(5-metyl-3-triflometyl-1H-pyrazol-1-yl)-axetyl]-piperidin-4-yl}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl]-4-thiazolcacboxamid, 3-[5-(4-clo-phenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin, pyrisoxazol, S-allyl este của axit 5-amino-2-isopropyl-3-oxo-4-ortho-tolyl-2,3-dihydro-pyrazol-1 cacbothioic, amit của axit N-(6-methoxy-pyridin-3-yl) xyclopropancacboxylic, 5-clo-1 (4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-2-metyl-1H-benzoimidazol, 2-(4-clo-phenyl)-N-[4-(3,4-dimethoxy-phenyl)-isoxazol-5-yl]-2-prop-2-ynyloxy-axetamid,.

F.XI) Chất điều hòa sinh trưởng: axit absxisc, amidochlor, ancymidol, 6-benzylaminopurine, brassinolide, butralin, chlormequat (chlormequat clorua), choline clorua, cyclanilide, daminozide, dikegulac, dimethipin, 2,6-dimetyluridine, ethephon,

flumetralin, flurprimidol, fluthiacet, forchlorfenuron, gibberellic acid, inabenfide, indole-3-acetic acid, maleic hydrazit, mefluidide, mepiquat (mepiquat clorua), naphthaleneacetic acid, N 6-benzyladenine, paclobutrazol, prohexadione (prohexadione-canxi), prohydrojasmon, thidiazuron, triapenthenol, tributyl phosphorotrithioate, 2,3,5 tri iodobenzoic acid, trinexapac-etyl và uniconazol;

F.XII) Tác nhân phòng trừ sinh học

Ampelomyces quisqualis (ví dụ AQ 10[®] từ Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Germany), *Aspergillus flavus* (ví dụ AFLAGUARD[®] từ Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (ví dụ BOTECTOR[®] từ bio-ferm GmbH, Germany), *Bacillus pumilus* (ví dụ NRRL Accession No. B-30087 in SONATA[®] và BALLAD[®] Plus từ AgraQuest Inc., USA), *Bacillus subtilis* (ví dụ isolat NRRL-Nr. B-21661 trong RHAPSODY[®], SERENADE[®] MAX và SERENADE[®] ASO từ AgraQuest Inc., USA), *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (ví dụ TAEGRO[®] từ Novozyme Biologicals, Inc., USA), *Candida oleophila* I-82 (ví dụ ASPIRE[®] từ Ecogen Inc., USA), *Candida saitoana* (ví dụ BIOCURE[®] (trong hỗn hợp với lysozym) và BIOCOAT[®] từ Micro Flo Company, USA (BASF SE) và Arysta), Chitosan (ví dụ ARMOUR-ZEN từ BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea* f. *catenulata*, cũng được gọi là *Gliocladium catenulatum* (ví dụ isolat J1446: PRESTOP[®] từ Verdera, Finland), *Coniothyrium minitans* (ví dụ CONTANS[®] từ Propytha, Germany), *Cryphonectria parasitica* (ví dụ *Endothia parasitica* từ CNICM, France), *Cryptococcus albidus* (ví dụ YIELD PLUS[®] từ Anchor Bio-Technologies, South Africa), *Fusarium oxysporum* (ví dụ BIOFOX[®] từ S.I.A.P.A., Italy, FUSACLEAN[®] từ Natural Plant Protection, France), *Metschnikowia fructicola* (ví dụ SHEMER[®] từ Agrogreen, Israel), *Microdochium dimerum* (ví dụ ANTIBOT[®] từ Agrauxine, France), *Phlebiopsis gigantea* (ví dụ ROTSOP[®] từ Verdera, Finland), *Pseudozyma flocculosa* (ví dụ SPORODEX[®] từ Plant Products Co. Ltd., Canada), *Pythium oligandrum* DV74 (ví dụ POLYVERSUM[®] từ Remeslo SSRO, Biopreparaty, Czech Rep.), *Reynoutria sachlinensis* (ví dụ REGALIA[®] từ Marrone BioInnovations, USA), *Talaromyces flavus* V117b (ví dụ PROTUS[®] từ Propytha, Germany), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (ví dụ ECO-HOPE[®] từ Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japan), *T. atroviride* LC52 (ví dụ SENTINEL[®] từ Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (ví dụ PLANTSHIELD[®] der Firma BioWorks Inc., USA), *T.*

harzianum TH 35 (ví dụ ROOT PRO® từ Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (ví dụ TRICHODEX® và TRICHODERMA 2000® từ Mycontrol Ltd., Israel và Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* và *T. viride* (ví dụ TRICHOPEL từ Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 và *T. viride* ICC080 (ví dụ REMEDIER® WP từ Isagro Ricerca, Italy), *T. polysporum* và *T. harzianum* (ví dụ BINAB® từ BINAB Bio-Innovation AB, Sweden), *T. stromaticum* (ví dụ TRICOVAB® từ C.E.P.L.A.C., Brazil), *T. virens* GL-21 (ví dụ SOILGARD® từ Certis LLC, USA), *T. viride* (ví dụ TRIECO® từ Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIO-CURE® F từ T. Stanes & Co. Ltd., Indien), *T. viride* TV1 (ví dụ T. viride TV1 từ Agribiotec srl, Italy), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (ví dụ BOTRY-ZEN® từ Botry-Zen Ltd, NZ)..

Động vật gây hại, nghĩa là các côn trùng, động vật thuộc lớp nhện và giun tròn, thực vật, đất trồng hoặc nước trong đó thực vật đang phát triển có thể được tiếp xúc với hợp chất có công thức (I) theo sáng chế hoặc (các) chế phẩm chứa chúng bằng phương pháp ứng dụng bất kỳ đã biết trong lĩnh vực. Như vậy, "bước cho tiếp xúc" bao gồm cả tiếp xúc trực tiếp (đưa hợp chất/các chế phẩm trực tiếp lên động vật gây hại hoặc thực vật, thường với lá cây, thân hoặc rễ cây) và tiếp xúc không trực tiếp (đưa hợp chất/các chế phẩm vào vị trí của động vật gây hại hoặc thực vật).

Hợp chất có công thức (I) hoặc các chế phẩm chống lại loài gây hại chứa chúng có thể được dùng để bảo vệ thực vật đang sinh trưởng và cây trồng khỏi sự tấn công hoặc xâm nhiễm bởi động vật gây hại, đặc biệt là các côn trùng, nhện hoặc động vật thuộc lớp nhện bằng cách cho cây/cây trồng tiếp xúc với lượng hợp chất có công thức (I) có tác dụng diệt loài gây hại. Thuật ngữ "cây trồng" được dùng để chỉ cả cây trồng đang sinh trưởng và đã được thu hoạch.

Hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm chứa chúng cụ thể là quan trọng trong việc phòng trừ vô số côn trùng trên thực vật đã được trồng khác nhau, như ngũ cốc, cây có củ, cây dầu, rau, gia vị, cây cảnh, ví dụ hạt giống lúa mì cứng và lúa mì khác, lúa mạch, yến mạch, lúa mạch đen, ngô (ngô cỏ khô và ngô đường / ngô ngọt và ở ruộng), đậu tương, cây dầu, họ thập tự, bông, hướng dương, chuối, lúa, hạt cải dầu, củ cải, củ cải đường, củ cải đường cho chăn nuôi, cà, khoai tây, củ, bắp cải, vừng củ, củ cho chăn nuôi, cà chua, tỏi tây, bí ngô/bí, bắp cải, rau diếp băng, hạt tiêu, dưa chuột, dưa, họ cải bắp, dưa, đậu, đậu Hà Lan, tỏi, hành tây, cà rốt, thực vật có củ như khoai tây, mía,

thuốc lá, nho, dã yên thảo, phong lữ/thiên trúc quỳ, cây hoa bướm và cây bóng nước.

Hợp chất theo sáng chế được dùng như nó vốn có hoặc dưới dạng các chế phẩm bằng cách xử lý các côn trùng hoặc thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, như hạt giống, đất trồng, bề mặt, vật liệu hoặc phòng cần bảo vệ khỏi sự tấn công bởi côn trùng bằng lượng hợp chất có công thức (I) có tác dụng diệt côn trùng. Việc áp dụng có thể được thực hiện cả trước và sau khi lây nhiễm vào thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, như hạt giống, đất trồng, bề mặt, vật liệu hoặc phòng bởi côn trùng.

Sáng chế cũng bao gồm phương pháp chống lại động vật gây hại bao gồm bước cho động vật gây hại, nơi ở của chúng, nơi sinh sản, nguồn cung cấp thức ăn, thực vật được trồng, hạt giống, đất trồng, diện tích, vật liệu hoặc môi trường trong đó động vật gây hại sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng, hoặc vật liệu, thực vật, hạt giống, đất trồng, bề mặt hoặc khoảng không được bảo vệ khỏi sự tấn công hoặc gây nhiễm của động vật tiếp xúc với lượng hỗn hợp của ít nhất một hợp chất có công thức (I) có tác dụng diệt loài gây hại.

Ngoài ra, động vật gây hại có thể được phòng trừ bằng cách cho loài gây hại đích, nguồn cung cấp thức ăn, môi trường sống, nơi sinh sản của nó hoặc vị trí của nó tiếp xúc với lượng hợp chất có công thức (I) tác dụng chống lại loài gây hại. Như vậy, việc sử dụng có thể được thực hiện trước hoặc sau khi lây nhiễm ở vị trí, cây trồng đang sinh trưởng, hoặc cây trồng được thu hoạch bởi loài gây hại.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được dùng ngăn ngừa cho các vị trí ở đó sự xuất hiện của loài gây hại được dự tính.

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể dùng để bảo vệ thực vật đang sinh trưởng không bị tấn công hoặc xâm nhiễm bởi loài gây hại bằng cách cho thực vật tiếp xúc với lượng hợp chất có công thức (I) tác dụng chống lại loài gây hại. Như vậy, "tiếp xúc" bao gồm cả tiếp xúc trực tiếp (đưa hợp chất/các chế phẩm trực tiếp lên loài gây hại và/hoặc cây - thường vào lá cây, thân hoặc rễ cây) và tiếp xúc không trực tiếp (đưa hợp chất/các chế phẩm vào vị trí của loài gây hại và/hoặc thực vật).

"Vị trí" có nghĩa là nơi ở, nơi sinh sản, thực vật, hạt giống, đất trồng, diện tích, vật liệu hoặc môi trường trong đó loài gây hại hoặc ký sinh trùng sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng.

Thuật ngữ "vật liệu nhân giống thực vật" được hiểu là biểu thị tất cả các bộ phận sinh sản của thực vật như hạt giống và vật liệu sinh dưỡng thực vật như các đoạn cắt và củ (ví dụ khoai tây), có thể dùng để nhân giống cây. Thuật ngữ này bao gồm hạt giống, rễ, quả, củ, hành, thân bò, chồi non, mầm và các phần khác của thực vật. Các cây con và thực vật non, mà được cấy ghép sau khi nảy mầm hoặc sau khi nhô lên từ đất trồng, cũng có thể được bao gồm. Các vật liệu nhân giống thực vật này có thể được xử lý để phòng bệnh bằng hợp chất bảo vệ thực vật ở lúc trồng hoặc cấy ghép thực vật hoặc là trước lúc đó.

Thuật ngữ "thực vật được trồng" phải được hiểu là bao gồm thực vật được cải biến bằng việc nhân giống, sinh đột biến hoặc kỹ thuật di truyền. Các thực vật điều biến di truyền là thực vật, mà vật liệu di truyền được điều biến bằng việc dùng kỹ thuật tái tổ hợp ADN dưới điều kiện tự nhiên không thể dễ dàng thu được bằng cách lai chéo, đột biến hoặc tái tổ hợp tự nhiên. Thông thường, một hoặc nhiều gen được hợp nhất lại thành vật liệu di truyền của thực vật được điều biến di truyền để cải thiện một số đặc tính của cây. Các cải biến di truyền này cũng bao gồm nhưng không giới hạn ở cải biến sau dịch mã hướng đích của (các) poly protein (oligo- hoặc polypeptit) ví dụ bằng cách glycosyl hóa hoặc bổ sung polyme như các gốc được prenyl hóa, axetylat hóa hoặc farnesyl hóa hoặc các gốc PEG (ví dụ như được bộc lộ trong Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct;10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Biomaterials. 2001 Mar;22(5):405-17, Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật chịu được việc sử dụng các loại thuốc diệt cỏ cụ thể, như chất ức chế hydroxy-phenylpyruvat dioxygenaza (HPPD); chất ức chế axetolactat synthaza (ALS), như sulfonyl ure (xem ví dụ US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) hoặc imidazolinon (xem ví dụ US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); chất ức chế enolpyruvylshikimate-3-phosphat synthaza (EPSPS), như glyphosat (xem ví dụ WO 92/00377); chất ức chế glutamin synthetaza (GS), như glufosinat (xem ví dụ EP-A-

0242236, EP-A-242246) hoặc thuốc diệt cỏ oxynil (xem ví dụ US 5,559,024) là kết quả của các phương pháp nhân giống hoặc kỹ thuật di truyền thông thường. Vài thực vật được trồng có khả năng chịu được thuốc diệt cỏ bằng phương pháp nhân giống thông thường (sinh đột biến), ví dụ Clearfield® summer rape (Canola) chịu được các imidazolinon, ví dụ imazamox. Phương pháp kỹ thuật di truyền được dùng để tạo ra thực vật được trồng, như đậu tương, bông, ngô, củ cải và cây cho chăn nuôi, chịu được thuốc diệt cỏ, như glyphosat và glufosinat, một vài trong số chúng có bán trên thị trường với tên thương mại là RoundupReady® (glyphosate) và LibertyLink® (glufosinat).

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật mà bằng cách sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp ADN có thể tổng hợp một hoặc nhiều protein có tác dụng diệt côn trùng, đặc biệt là các protein đã biết từ giống vi khuẩn *Bacillus*, cụ thể là từ *Bacillus thuringiensis*, như nội độc tố a, ví dụ CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) hoặc Cry9c; các protein sinh dưỡng có tác dụng chống lại côn trùng (vegetative insecticidal proteins - VIP), ví dụ VIP1, VIP2, VIP3 hoặc VIP3A; các protein có tác dụng chống lại côn trùng của vi khuẩn ở giun tròn, ví dụ *Photorhabdus* spp. hoặc *Xenorhabdus* spp.; độc tố được tạo ra bởi động vật, như độc tố bọ cạp, độc tố nhện, độc tố ong vò vẽ, hoặc độc tố thần kinh ở côn trùng cụ thể khác; độc tố được tạo ra bởi nấm, độc tố streptomyxet, lectin thực vật, như các lectin đậu Hà Lan hoặc lúa mạch; agglutinin; chất ức chế proteinaza, như chất ức chế trypsin, chất ức chế serin proteaza, các chất ức chế patatin, cystatin hoặc papain; các protein bất hoạt ribosom (ribosome-inactivating proteins - RIP), như rixin, maize-RIP, abrin, luffin, saporin hoặc bryodin; enzym trao đổi chất steroid, như 3-hydroxysteroid oxidaza, ecdysteroid-IDP-glycosyl-transferaza, cholesterol oxidaza, chất ức chế ecdyson hoặc HMG-CoA-reductaza; tác nhân ngăn chặn kênh ion, như tác nhân ngăn chặn các kênh canxi hoặc natri; esterase hormon kích sâu non; thụ thể hormon lợi tiểu (thụ thể helicokinin); stilben synthaza, bibenzyl synthaza, chitinaza hoặc glucanaza. Theo ngữ cảnh của sáng chế các protein có tác dụng chống lại côn trùng hoặc độc tố này cũng được hiểu là tiền độc tố, protein lai, các protein được cắt cụt hoặc được điều biến theo cách khác. Protein lai được đặc trưng bởi kết hợp các miền protein mới, (xem, ví dụ WO 02/015701). Các ví dụ khác về độc tố hoặc thực vật được cải biến di truyền có khả năng tổng hợp các độc tố như vậy được bộc lộ, ví dụ, trong EP-A 374 753, WO 93/007278,

WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 và WO 03/052073. Phương pháp tạo ra thực vật được cải biến di truyền này nhìn chung đã biết bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực và được mô tả, ví dụ, trong các công bố được đề cập ở trên. Các protein có tác dụng diệt côn trùng chứa trong thực vật được cải biến di truyền bảo vệ thực vật tạo ra các protein này khỏi các loài gây hại từ một số nhóm phân loại của động vật chân đốt, cụ thể là bộ cánh cứng (lớp cánh cứng), ruồi (lớp côn trùng hai cánh), và bướm và ngài (sâu bộ cánh vẩy) và giun tròn ký sinh cây (lớp giun tròn).

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật bằng việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp ADN có thể tổng hợp một hoặc nhiều protein để tăng tính kháng hoặc sự chịu đựng của các thực vật này với nguồn bệnh vi khuẩn, virus hoặc nấm. Các ví dụ về protein này được gọi là "protein liên quan đến sự sinh bệnh" (protein PR, xem, ví dụ EP-A 0 392 225), gen kháng bệnh thực vật (ví dụ giống khoai tây, biểu hiện gen kháng hoạt động chống lại *phytophthora infestans* có nguồn gốc từ khoai tây đại mexico *Solanum bulbocastanum*) hoặc T4-lyso-zym (ví dụ giống khoai tây có thể tổng hợp các protein có tính kháng tăng chống lại vi khuẩn như *Erwinia amylovora*). Phương pháp tạo ra thực vật được cải biến di truyền này nhìn chung đã biết bởi người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực và được mô tả, ví dụ, trong các công bố được đề cập ở trên.

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật bằng việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp ADN có thể tổng hợp một hoặc nhiều protein để tăng năng suất (ví dụ sản xuất sinh khối, sản lượng ngũ cốc, hàm lượng tinh bột, hàm lượng dầu hoặc hàm lượng protein), tính chịu hạn hán, độ mặn hoặc các yếu tố môi trường hạn chế sinh trưởng khác hoặc tính chịu loài gây hại và các nguồn bệnh nấm, vi khuẩn hoặc virus của các thực vật này.

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật mà bằng việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp ADN chứa lượng biến đổi của các chất có hàm lượng hoặc các chất mới có hàm lượng đặc trưng để cải thiện dinh dưỡng ở người hoặc động vật, ví dụ cây dầu tạo ra axit béo omega-3 mạch dài có lợi cho sức khỏe hoặc axit béo omega-9 không no (ví dụ Nexera® rape).

Thuật ngữ "thực vật được trồng" cũng được hiểu bao gồm thực vật mà bằng việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp ADN chứa lượng biến đổi của các chất có hàm lượng hoặc

các chất mới có hàm lượng, đặc trưng để cải thiện sự sản xuất vật liệu thô, ví dụ khoai tây tạo ra lượng amylopectin tăng (ví dụ khoai tây Amflora®).

Nói chung, "lượng hữu hiệu có tác dụng trừ sâu" có nghĩa là lượng thành phần hoạt tính (trong bản mô tả này là hợp chất có công thức (I)) cần thiết để đạt được tác dụng có thể quan sát được đối với sự sinh trưởng, bao gồm hiệu quả với bệnh hoại tử, sự chết, sự làm chậm, sự phòng bệnh, và sự loại bỏ, sự phá hoại, hoặc theo cách khác làm giảm sự xuất hiện và hoạt tính của sinh vật đích. Lượng hữu hiệu có tác dụng trừ sâu có thể biến đổi với các hợp chất/chế phẩm khác nhau được dùng trong sáng chế. Lượng hữu hiệu có tác dụng trừ sâu của các chế phẩm cũng sẽ biến đổi theo điều kiện hiện tại như tác dụng và khoảng thời gian trừ sâu mong muốn, thời tiết, loài đích, vị trí, phương thức sử dụng, và tương tự.

Trong trường hợp xử lý đất trồng hoặc dùng cho nơi cư trú hoặc tổ của loài gây hại, lượng thành phần hoạt tính nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 500 g trên 100 m², tốt hơn là từ 0,001 đến 20 g trên 100 m².

Tỷ lệ áp dụng thông thường trong bảo vệ vật liệu là, ví dụ, từ 0,01 g đến 1000 g thành phần hoạt tính trên một m² vật liệu xử lý, mong muốn là từ 0,1 g đến 50 g trên một m².

Các chế phẩm diệt côn trùng để dùng trong ngâm tẩm vật liệu thường chứa từ 0,001 đến 95 % khối lượng, tốt hơn là từ 0,1 đến 45% khối lượng, và tốt hơn nữa là từ 1 đến 25% khối lượng của ít nhất một chất xua đuổi và/hoặc thuốc trừ sâu.

Để dùng trong việc xử lý cây trồng, tỷ lệ áp dụng thành phần hoạt tính theo sáng chế có thể nằm trong khoảng 0,1 g đến 4000 g trên một hecta, mong muốn là từ 25 g đến 600 g trên một hecta, mong muốn nữa là từ 50 g đến 500 g trên một hecta.

Hợp chất có công thức (I) tác dụng thông qua cả tiếp xúc (qua đất trồng, chai, tường, màn, thảm, các phần thực vật hoặc các bộ phận động vật), và ăn uống (môi, hoặc phần thực vật).

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được dùng chống lại côn trùng gây hại không ở cây trồng, như kiến, mối, ong bắp cày, ruồi, muỗi, dế, hoặc gián. Để dùng chống lại loài gây hại không ở cây trồng này, hợp chất có công thức (I) tốt hơn là được dùng trong chế phẩm môi.

Môi có thể là chế phẩm lỏng, rắn hoặc bán rắn (ví dụ gel). Môi rắn có thể được tạo ra thành các hình và các dạng khác nhau thích hợp với ứng dụng tương ứng ví dụ hạt, khối, thanh, đĩa. Môi lỏng có thể được nạp vào các thiết bị khác nhau để đảm bảo sử dụng hợp cách, ví dụ vật chứa mở, thiết bị phun, nguồn giọt nhỏ, hoặc nguồn bay hơi. Các gel có thể dựa trên cơ sở nền nước hoặc dầu và có thể được bào chế theo nhu cầu cụ thể về các đặc tính kết dính, giữ ẩm hoặc lão hóa.

Môi được dùng trong chế phẩm là sản phẩm, hấp dẫn đủ để kích thích các côn trùng như kiến, mối, ong bắp cày, ruồi, muỗi, dế v.v. hoặc gián ăn nó. Sự hấp dẫn có thể được lôi kéo bằng việc sử dụng chất kích thích ăn hoặc pheromon giới tính. Chất kích thích thực phẩm được chọn, ví dụ, nhưng không duy nhất, từ động vật và/hoặc protein thực vật (món thịt, cá hoặc máu, các bộ phận côn trùng, lòng đỏ trứng), từ chất béo và dầu có nguồn gốc động vật và/hoặc cây, hoặc mono-, oligo- hoặc polyorganosaccharit, đặc biệt là từ sucroza, lactoza, fructoza, dextroza, glucoza, tinh bột, pectin hoặc ngay cả mật mía hoặc mật ong. Các phần tươi hoặc thối rữa của quả, cây trồng, thực vật, động vật, các côn trùng hoặc các phần cụ thể của chúng cũng có thể dùng làm chất kích thích ăn. Pheromon giới tính đã biết với nhiều côn trùng cụ thể. Pheromon cụ thể được nêu trong bản mô tả và đã biết với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực.

Để sử dụng trong các chế phẩm môi, hàm lượng thông thường của thành phần hoạt tính là từ 0,001% khối lượng tới 15% khối lượng, mong muốn là từ 0.001% khối lượng tới 5% khối lượng là thành phần hoạt tính.

Các chế phẩm của hợp chất có công thức (I) là sol khí (ví dụ trong lon phun), thuốc phun dầu hoặc thuốc phun bơm cao thích hợp cho người sử dụng không chuyên nghiệp để phòng trừ loài gây hại như ruồi, bọ chét, ve, muỗi hoặc gián. Công thức pha chế sol khí tốt hơn là gồm thành phần hoạt tính, các dung môi như rượu bậc thấp (ví dụ metanol, etanol, propanol, butanol), keton (ví dụ axeton, metyl etyl keton), các hydrocarbon parafin (ví dụ dầu hỏa) có khoảng sôi nằm trong khoảng từ 50 tới 250°C, dimetylformamit, N-metylpyrrolidon, dimetyl sulfoxit, các hydrocacbon thơm như toluen, xylen, nước, chất phù trợ khác như chất nhũ hóa như sorbitol monooleat, oleyl etoxylat có 3-7 mol là etylen oxit, rượu béo etoxylat, dầu thơm như tinh dầu, các este của axit béo trung bình với rượu bậc thấp, hợp chất cacbonyl thơm, nếu chất ổn định thích hợp như natri benzoat, chất hoạt động bề mặt lưỡng tính, epoxit bậc thấp, trietyl

orthoformat và, nếu đòi hỏi, tác nhân đẩy như propan, butan, nitơ, khí nén, dimetyl ete, cacbon dioxit, nitơ oxit, hoặc hỗn hợp các khí này.

Các chế phẩm phun dầu khác với công thức pha chế sol khí là không sử dụng tác nhân đẩy.

Để sử dụng trong các chế phẩm phun, hàm lượng thành phần hoạt tính nằm trong khoảng từ 0,001 đến 80% khối lượng, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 50% khối lượng và càng tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 15% khối lượng.

Hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm tương ứng của nó cũng có thể được sử dụng ở nhang muỗi và chế phẩm xông, ống khói, tấm làm bay hơi hoặc thiết bị làm bay hơi trong thời gian dài và cũng ở giấy bướm, đệm bướm hoặc các hệ thống làm bay hơi không phụ thuộc vào nhiệt khác.

Phương pháp để phòng trừ các bệnh truyền nhiễm được truyền bởi côn trùng (ví dụ bệnh sốt rét, sốt xuất huyết và sốt vàng da, bệnh giun chỉ bạch huyết, và bệnh leishmania) bằng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm tương ứng của nó cũng bao gồm bước xử lý bề mặt túp lều và nhà, phun khí và ngâm tấm rèm cửa, lều, vật phẩm phủ, màn, bẫy ruồi xexe hoặc tương tự. Các chế phẩm có tác dụng chống lại côn trùng để ứng dụng với sợi, vải, hàng dệt kim, sản phẩm không dệt, vật liệu đan lưới hoặc lá kim loại và bột tốt hơn là chũnhỗn hợp bao gồm thuốc trừ sâu, chất xua đuổi tùy ý và ít nhất một chất liên kết. Thuốc xua đuổi thích hợp ví dụ là N,N-Dietyl-meta-toluamit (DEET), N,N-dietylphenylaxetamit (DEPA), 1-(3-xyclohexan-1-yl-cacbonyl)-2-metylpiperin, lacton của axit (2-hydroxymetylxyclohexyl) axetic, 2-etyl-1,3-hexandiol, indalone, Metylneodecanamit (MNDA), pyrethroit không dung để phòng trừ côn trùng như {(+/-)-3-allyl-2-metyl-4-oxoxyclopent-2-(+)-enyl-(+)-trans-chrysantemate (Esbiothrin), chất xua đuổi có nguồn gốc từ hoặc giống với chất chiết cây như limonen, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol hoặc chất chiết cây thô từ thực vật như Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogan martinii, Cymbopogan citratus (cây sả chanh), Cymopogan nartdus (citronella). Chất liên kết thích hợp được chọn ví dụ từ polyme và copolyme của các este vinyl của axit béo (như vinyl axetat và vinyl versatat), acrylic và các este metacrylic của rượu, như butyl acrylat, 2-etylhexylacrylat, và metyl acrylat, các hydrocacbon không no mono- và di-etylenically, như styren, và

các dien béo, như butadien.

Sự ngâm tẩm rèm cửa và màn được tiến hành chung bằng cách nhúng vật liệu sợi vào nhũ tương hoặc thể phân tán của thuốc trừ sâu hoặc phun chúng lên màn.

Hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm của nó có thể được dùng để bảo vệ các vật liệu làm bằng gỗ như cây, hàng rào ban, tà vẹt, v.v. và các tòa nhà như nhà, nhà phụ, nhà máy, mà còn vật liệu xây dựng, đồ đạc, da, sợi, sản phẩm nhựa vinyl, dây điện và cáp v.v. khỏi kiến và/hoặc mối, và để phòng trừ kiến và mối khỏi làm hại tới cây trồng hoặc người (ví dụ khi loài gây hại tràn ngập vào nhà và công trình công cộng). Hợp chất có công thức (I) được dùng không chỉ với bề mặt đất trồng xung quanh hoặc vào đất trồng dưới sàn để bảo vệ các vật liệu làm bằng gỗ nhưng nó cũng có thể được dùng với các sản phẩm gỗ xẻ như bề mặt của bê tông dưới sàn, các vị trí hốc tường, dầm, gỗ dán, đồ đạc, v.v, sản phẩm làm bằng gỗ như tấm mùn cửa, nửa bảng, v.v. và sản phẩm nhựa vinyl như dây điện bọc, tấm nhựa vinyl, vật liệu cách nhiệt như bọt styren, v.v. Trong trường hợp sử dụng chống lại kiến làm hại tới cây trồng hoặc người, chất phòng trừ kiến theo sáng chế được dùng với cây trồng hoặc đất trồng xung quanh, hoặc được dùng trực tiếp vào tổ kiến hoặc tương tự.

Hợp chất có công thức (I) cũng thích hợp cho xử lý hạt giống để bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại côn trùng, cụ thể là loài gây hại côn trùng sống trong đất và rễ và chồi non của cây thu được chống lại loài gây hại đất trồng và các côn trùng lá.

Hợp chất có công thức (I) có thể dùng cụ thể là để bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại đất trồng và rễ và chồi non của thực vật thu được chống lại loài gây hại đất trồng và các côn trùng lá. Sự bảo vệ rễ và chồi non của thực vật thu được được ưu tiên. Ưu tiên nữa là sự bảo vệ chồi non của thực vật thu được khỏi côn trùng đục và hút, trong đó bảo vệ khỏi rệp được ưu tiên nhất.

Sáng chế do đó bao gồm phương pháp để bảo vệ hạt giống khỏi côn trùng, cụ thể là khỏi các côn trùng đất trồng và rễ và chồi non của cây giống khỏi côn trùng, cụ thể là khỏi các côn trùng đất trồng và lá, phương pháp này bao gồm bước cho hạt giống trước gieo hạt và/hoặc sau tiên nảy mầm tiếp xúc với hợp chất có công thức chung (I) hoặc muối của chúng. Ưu tiên cụ thể là phương pháp, trong đó rễ và chồi non của cây được bảo vệ, tốt hơn nữa là phương pháp, trong đó chồi non thực vật được bảo vệ khỏi côn

trùng đục và hút, càng tốt hơn là phương pháp, trong đó chồi non thực vật được bảo vệ khỏi giống bị chết.

Thuật ngữ hạt giống bao gồm hạt giống và mầm cây của tất cả loại bao gồm nhưng không giới hạn ở hạt giống thật, miếng hạt giống, ống hút, thân hành, hành, quả, củ, các loại ngũ cốc, các đoạn cắt, chồi non bị cắt và tương tự và có nghĩa là hạt giống thật theo phương án ưu tiên.

Thuật ngữ xử lý hạt giống bao gồm tất cả kỹ thuật xử lý hạt giống thích hợp đã biết trong lĩnh vực, như xử lý hạt giống, phủ hạt giống, rây hạt giống, ngâm hạt giống và tạo viên hạt giống.

Sáng chế cũng bao gồm việc bọc hạt giống bằng hoặc chứa hợp chất có công thức (I). Thuật ngữ "bọc bằng và/hoặc chứa" nhìn chung có nghĩa rằng thành phần hoạt tính là cho hầu hết các phần trên bề mặt của sản phẩm nhân giống ở thời điểm sử dụng, mặc dù phần lớn hơn hoặc nhỏ hơn của thành phần có thể thâm nhập vào sản phẩm nhân giống, phụ thuộc vào phương pháp sử dụng. Khi sản phẩm nhân giống được trồng (lại), nó có thể hấp thu thành phần hoạt tính.

Hạt giống thích hợp là hạt giống ngũ cốc, cây có củ, cây dầu, thực vật, gia vị, cây cảnh, ví dụ hạt giống của lúa mì cứng và lúa mạch khác, lúa mạch, yến mạch, lúa mạch đen, ngô (ngô cho chăn nuôi và ngô đường / ngọt và ngô ruộng), đậu tương, cây dầu, họ thập tự, bông, hướng dương, chuối, lúa, hạt cải dầu, củ cải, củ cải đường, củ cải đường cho chăn nuôi, cà, khoai tây, củ, bãi củ, tăng củ, củ cho chăn nuôi, cà chua, tỏi tây, bí ngô/bí, bắp cải, rau diếp băng, hạt tiêu, dưa chuột, dưa, loài Brassica, dưa, đậu, đậu Hà Lan, tỏi, hành tây, cà rốt, thực vật có củ như khoai tây, mía, thuốc lá, nho, dã yên thảo, phong lữ/thiên trúc quỳ, cây hoa bướm và cây bóng nước.

Thêm vào đó, hợp chất có công thức (I) cũng có thể được dung để xử lý hạt giống từ thực vật, chịu đựng tác dụng của thuốc diệt cỏ hoặc thuốc trừ nấm hoặc thuốc trừ sâu tới sinh sản, bao gồm phương pháp kỹ thuật di truyền. Ví dụ, hợp chất có công thức (I) có thể được dùng để xử lý hạt giống từ thực vật, mà chịu đựng được thuốc diệt cỏ từ nhóm gồm sulfonylure, imidazolinon, glufosinate-amoni hoặc glyphosate-isopropylamoni và các hoạt chất tương tự (xem ví dụ, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EP-A-0257993, U.S. Pat. No. 5,013,659)

hoặc ở thực vật biến đổi gen, ví dụ bông, với khả năng tạo ra độc tố *Bacillus thuringiensis* (độc tố Bt) mà khiến thực vật chịu đựng được một số loài gây hại (EP-A-0142924, EP-A-0193259).

Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) cũng có thể được dùng để xử lý hạt giống từ thực vật, mà các đặc tính đã được cải biến so với thành phần thực vật hiện tại, mà có thể được tạo ra ví dụ bằng phương pháp nhân giống truyền thống và/hoặc sinh đột biến, hoặc bằng các phương pháp tái tổ hợp). Ví dụ, số trường hợp được mô tả của các biến thể tái tổ hợp của thực vật cho mục đích điều biến tinh bột được tổng hợp trong thực vật (ví dụ WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) hoặc của thực vật biến đổi gen có chế phẩm axit béo được điều biến (WO 91/13972).

Xử lý hạt giống sử dụng hợp chất có công thức (I) được thực hiện bằng cách phun hoặc bằng cách rải hạt giống trước khi gieo hạt thực vật và trước khi thực vật nhô lên.

Các chế phẩm đặc biệt là có thể dùng để xử lý hạt giống là ví dụ:

- A Chất cô đặc hòa tan (SL, LS)
- D Nhũ tương (EW, EO, ES)
- E Huyền phù (SC, OD, FS)
- F Hạt có thể phân tán trong nước và hạt hòa tan trong nước (WG, SG)
- G Bột có thể phân tán trong nước và bột hòa tan trong nước (WP, SP, WS)
- H Các chế phẩm gel (GF)
- I Bột mịn (dustable powders - DP, DS)

Các chế phẩm xử lý hạt giống thông thường bao gồm ví dụ chất cô đặc chảy được FS, dung dịch LS, bột cho xử lý khô DS, bột có thể phân tán trong nước để xử lý huyền phù WS, bột hòa tan trong nước SS và nhũ tương ES và EC và chế phẩm gel GF. Các chế phẩm có thể được dùng với hạt giống được pha loãng hoặc không được pha loãng. Việc sử dụng cho hạt giống được thực hiện trước gieo hạt, hoặc là trực tiếp lên hạt giống hoặc sau khi nảy hạt giống mầm.

Theo phương án ưu tiên chế phẩm FS được dùng để xử lý hạt giống. Thông thường, chế phẩm FS có thể chứa 1-800 g/l thành phần hoạt tính, 1-200 g/l chất hoạt

động bề mặt, 0 tới 200 g/l chất chống đông, 0 tới 400 g/l chất liên kết, 0 tới 200 g/l chất màu và lên tới 1 lít dung môi, tốt hơn là nước.

Đặc biệt là ưu tiên các chế phẩm FS của hợp chất có công thức (I) để xử lý hạt giống thông thường chứa từ 0,1 tới 80% khối lượng (1 tới 800 g/l) là thành phần hoạt tính, từ 0,1 tới 20% khối lượng (1 tới 200 g/l) là ít nhất một chất hoạt động bề mặt, ví dụ 0,05 tới 5% khối lượng là chất thấm ướt và từ 0,5 tới 15% khối lượng là chất phân tán, lên tới 20% khối lượng, ví dụ từ 5 tới 20% là chất chống đông, từ 0 tới 15% khối lượng, ví dụ 1 tới 15% khối lượng là chất màu và/hoặc thuốc nhuộm, từ 0 tới 40% khối lượng, ví dụ 1 tới 40% khối lượng là chất liên kết (keo / chất bám dính), tùy ý lên tới 5% khối lượng, ví dụ từ 0,1 tới 5% khối lượng là chất cô đặc, tùy ý từ 0,1 tới 2% là chất chống tạo bọt, và chất bảo quản tùy ý như chất diệt khuẩn, chống oxy hóa hoặc tương tự, ví dụ với lượng từ 0,01 tới 1% khối lượng và chất làm đầy/dung môi lên tới 100% khối lượng.

Các chế phẩm xử lý hạt giống cũng có thể bổ sung chứa chất liên kết và chất tạo màu tùy ý.

Chất liên kết có thể được bổ sung để cải thiện sự bám dính của vật liệu hoạt tính lên hạt giống sau khi xử lý. Chất liên kết thích hợp là homo- và copolyme từ alkylen oxit như etylen oxit hoặc propylen oxit, polyvinylaxetat, rượu polyvinyl, polyvinylpyrrolidon, và copolyme của chúng, etylen-vinyl axetat copolyme, acrylic homo- và copolyme, polyetyleneamin, polyetyleneamit và polyetyleneimin, polysacarit như xenluloza, tyloza và tinh bột, polyolefin homo- và copolyme như olefin/maleic anhydrit copolyme, polyuretan, polyeste, polystyren homo và copolyme.

Tùy ý, chất tạo màu cũng có thể được bao gồm trong chế phẩm. Chất tạo màu hoặc thuốc nhuộm thích hợp cho các chế phẩm xử lý hạt giống là Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112, C.I. Solvent Red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red

108.

Các ví dụ về chất keo là caragin (Satiagel®)

Trong xử lý hạt giống, tỷ lệ sử dụng của hợp chất I nhìn chung từ 0,1 g đến 10 kg tính trên 100 kg hạt giống, tốt hơn là từ 1 g đến 5 kg tính trên 100 kg hạt giống, tốt hơn nữa là từ 1 g đến 1000 g tính trên 100 kg hạt giống và cụ thể là từ 1 g đến 200 g tính trên 100 kg hạt giống.

Sáng chế do đó cũng đề cập đến hạt giống chứa hợp chất có công thức (I), hoặc muối có thể dùng trong nông nghiệp của I, như được xác định trong bản mô tả này. Lượng hợp chất I hoặc muối có thể dùng trong nông nghiệp của chúng nhìn chung sẽ thay đổi từ 0,1 g tới 10 kg tính theo 100 kg của hạt giống, tốt hơn là từ 1 g tới 5 kg tính theo 100 kg của hạt giống, cụ thể là từ 1 g tới 1000 g tính theo 100 kg của hạt giống. Với cây trồng cụ thể như rau diếp tỷ lệ có thể cao hơn.

Hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng cũng đặc biệt thích hợp để sử dụng chống lại vật ký sinh trong và trên động vật.

Do đó mục đích của sáng chế cũng là để đưa ra phương pháp mới để phòng trừ vật ký sinh trong và trên động vật. Mục đích khác của sáng chế là đưa ra thuốc chống lại loài gây hại cho động vật an toàn hơn. Mục đích khác của sáng chế còn là đưa ra thuốc chống lại loài gây hại cho động vật mà có thể sử dụng với liều thấp hơn thuốc chống lại loài gây hại hiện tại. Mục đích khác của sáng chế là đưa ra thuốc chống lại loài gây hại cho động vật, mà đưa ra việc phòng trừ ký sinh trùng lâu dài.

Sáng chế cũng đề cập đến các chế phẩm chứa lượng tác dụng chống lại vật ký sinh của hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng và chất mang có thể chấp nhận, để chống lại vật ký sinh trong và trên động vật.

Sáng chế cũng đưa ra phương pháp để xử lý, phòng trừ, ngăn ngừa và bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm và sự lây nhiễm bởi vật ký sinh, bao gồm dùng hoặc sử dụng cho động vật qua đường miệng, tại chỗ hoặc ngoài đường tiêu hóa lượng tác dụng chống lại vật ký sinh của hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng hoặc chế phẩm chứa nó.

Sáng chế cũng đưa ra quy trình để điều chế chế phẩm để xử lý, phòng trừ, ngăn ngừa hoặc bảo vệ động vật chống lại sự xâm nhiễm hoặc sự lây nhiễm bởi vật ký sinh bao gồm lượng tác dụng chống lại vật ký sinh của hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng hoặc chế phẩm chứa nó.

Hoạt tính của hợp chất chống lại loài gây hại dùng trong nông nghiệp không gọi ra sự thích hợp của chúng để phòng trừ vật nội và ngoại ký sinh trong và trên động vật mà đòi hỏi, ví dụ, liều thấp, không nôn mửa trong trường hợp sử dụng qua đường miệng, khả năng tương thích trao đổi chất với động vật, đặc tính độc thấp, và xử lý an toàn.

Đáng ngạc nhiên là hiện tại đã tìm thấy hợp chất có công thức (I) thích hợp để chống lại vật nội và ngoại ký sinh trong và trên động vật.

Hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng và các chế phẩm chứa chúng tốt hơn là được dùng để phòng trừ và ngăn ngừa sự xâm nhiễm và lây nhiễm động vật bao gồm động vật máu nóng (bao gồm người) và cá. Chúng là ví dụ thích hợp để phòng trừ và ngăn ngừa sự xâm nhiễm và lây nhiễm ở động vật có vú như gia súc, cừu, heo, lạc đà, hươu, ngựa, lợn, gia cầm, thỏ, dê, chó và mèo, trâu nước, lừa, hươu hoang và tuần lộc, và cũng ở động vật lông mang như chồn, sóc sinsin và gấu trúc, các loài gia cầm như gà, ngỗng, gà tây và vịt và cá như cá nước ngọt và nước mặn như cá hồi, cá chép và lươn.

Hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng và các chế phẩm chứa chúng tốt hơn là được dùng để phòng trừ và ngăn ngừa sự xâm nhiễm và lây nhiễm ở động vật nuôi trong nhà, như chó hoặc mèo.

Sự xâm nhiễm ở động vật máu nóng và cá bao gồm, nhưng không giới hạn ở, chấy, rận cắn, ve, ấu trùng ruồi trâu ký sinh ở mũi, ruồi rận, ruồi đốt, ruồi muscoid, ruồi, ấu trùng ruồi myiasitic, bọ chigger, muỗi mắt, muỗi và bọ chét.

Hợp chất có công thức (I) hoặc chất đồng phân đối ảnh hoặc muối có thể chấp nhận trong thú y của chúng và các chế phẩm chứa chúng thích hợp để phòng trừ theo hệ thống và/hoặc không theo hệ thống của vật ngoại và/hoặc nội ký sinh. Chúng có hoạt tính chống lại tất cả hoặc một số giai đoạn phát triển.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt là có thể dùng để chống lại vật ngoại ký sinh.

Hợp chất có công thức (I) đặc biệt là có thể dùng để chống lại vật ký sinh của các loài và loài sau (ví dụ như được thống kê trong các loài gây hại đích ở trên nếu không được thống kê một cách rõ ràng dưới đây), tương ứng:

bọ chét (Siphonaptera);

gián (Blattaria - Blattodea);

ruồi, muỗi (Diptera);

chí (Phthiraptera);

ve và ve ký sinh (Parasitiformes) từ màng nhện;

Actinedida (Prostigmata) và Acaridida (Astigmata);

sâu bọ (Heteropterida);

Anoplurida, ví dụ *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., và *Solenopotes* spp; Mallophagida (subbộ *Armblycerina* và *Ischnocerina*), ví dụ *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., và *Felicola* spp;

Giun tròn thuộc lớp giun tròn, ví dụ Wipeworms và *Trichinosis* (*Trichosyringida*), ví dụ *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp; *Rhabditida*, ví dụ *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

Strongylida, ví dụ *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*., *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus* , *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus*, và *Diectophyma renale*;

Giun tròn ở đường ruột (*Ascaridida*), ví dụ *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara*

canis, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., và *Oxyuris equi*,

Camallanida, ví dụ *Dracunculus medinensis* (guinea worm)

Spirurida, ví dụ *Thelazia* spp., *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, và *Habronema* spp;

Giun đầu gai (*Acanthocephala*), ví dụ *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* và *Oncicola* spp,

Sán dẹp (*Plathelminthes*):

Sán (*Trematoda*), ví dụ *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., và *Nanocyetes* spp,

Cercomeromorpha, cụ thể là *Cestoda* (Tapeworms), ví dụ *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocostoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., và *Hymenolepis* spp.

Hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng cụ thể là có thể dùng để phòng trừ loài gây hại từ các bộ *Diptera*, *Siphonaptera* và *Ixodida*.

Ngoài ra, sử dụng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng để chống lại muỗi đặc biệt là được ưu tiên.

Sử dụng hợp chất có công thức I và các chế phẩm chứa chúng để chống lại ruồi là phương án ưu tiên khác theo sáng chế.

Ngoài ra, sử dụng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng để chống lại bọ chét là đặc biệt được ưu tiên.

Sử dụng hợp chất có công thức (I) và các chế phẩm chứa chúng để chống lại ve là phương án ưu tiên khác theo sáng chế.

Hợp chất có công thức (I) cũng đặc biệt là có thể dùng để chống lại vật nội ký sinh (giun tròn thuộc lớp giun tròn, giun đầu gai và sán dẹp).

Việc sử dụng có thể được thực hiện cả để phòng bệnh và trị bệnh. Việc sử dụng

(các) thành phần hoạt tính được thực hiện trực tiếp hoặc dưới dạng chế phẩm thích hợp, qua đường miệng, tại chỗ/quá da hoặc ngoài đường tiêu hóa. Thuật ngữ (các) thành phần hoạt tính như được dùng ở trên có nghĩa là chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) và (các) hợp chất có hoạt tính khác sau cùng.

Với việc sử dụng cho động vật máu nóng qua đường miệng, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế là thức ăn động vật, thức ăn động vật trộn trước, thức ăn động vật cô đặc, viên tròn, dung dịch, hồ bột, huyền phù, thuốc nước, gel, viên nén, viên to và viên nang. Thêm vào đó, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng cho động vật trong nước uống của chúng. Với việc sử dụng qua đường miệng, các dạng bào chế được chọn nên đưa ra cho động vật nằm trong khoảng 0,01 mg/kg tới 100 mg/kg trọng lượng cơ thể động vật tính theo ngày của hợp chất công thức (I), tốt hơn là nằm trong khoảng 0,5 mg/kg tới 100 mg/kg trọng lượng cơ thể động vật tính theo ngày.

Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng cho động vật ngoài đường tiêu hóa, ví dụ, bằng cách tiêm dạ cỏ, bắp, trong tĩnh mạch hoặc dưới da. Hợp chất có công thức (I) có thể được phân tán hoặc được hòa tan trong chất mang có thể chấp nhận về mặt sinh lý để tiêm dưới da. Ngoài ra, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế thành chất cấy để sử dụng dưới da. Thêm vào đó hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng cho động vật xuyên qua da. Với việc sử dụng ngoài đường tiêu hóa, các dạng bào chế được chọn nên đưa ra cho động vật nằm trong khoảng 0,01 mg/kg tới 100 mg/kg trọng lượng cơ thể động vật tính theo ngày của hợp chất có công thức (I).

Hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng tại chỗ cho động vật dưới dạng sáp, bụi, bột, đai, huy chương, thuốc phun, dầu gội, các chế phẩm chấm trên và rót trên và ở dạng thuốc mỡ hoặc nhũ tương dầu trong nước hoặc nước trong dầu. Với cách sử dụng bên ngoài, sáp và thuốc phun thông thường chứa nằm trong khoảng 0,5 ppm tới 5.000 ppm và tốt hơn là nằm trong khoảng 1 ppm tới 3.000 ppm hợp chất có công thức (I). Thêm vào đó, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế làm thỏ tai cho động vật, cụ thể là động vật bốn chân như gia súc và cừu. Các chế phẩm thích hợp là:

- Các dung dịch như dung dịch qua đường miệng, chất cô để sử dụng qua đường miệng sau khi pha loãng, dung dịch để dùng trên da hoặc trong khoang cơ thể, các chế phẩm rót trên, các gel;

- Nhũ tương và huyền phù để sử dụng qua đường miệng hoặc qua da; các chế phẩm bán rắn;

- Các chế phẩm trong đó thành phần hoạt tính được xử lý trong cơ sở thuốc mỡ hoặc trong cơ sở nhũ tương dầu trong nước hoặc nước trong dầu;

- Các chế phẩm rắn như bột, chất trộn trước hoặc chất cô, hạt, bột viên, viên tròn, viên to, viên nang; sol khí và thuốc để hít, và thành phần hoạt tính chứa sản phẩm được tạo hình.

Các chế phẩm thích hợp để tiêm được điều chế bằng hòa tan thành phần hoạt tính trong dung môi thích hợp và các thành phần khác bổ sung tùy ý như axit, bazơ, muối đệm, chất bảo quản, và chất làm tan. Dung dịch được lọc và được nạp khô.

Các dung môi thích hợp là các dung môi có thể chịu được về sinh lý như nước, alkanol như etanol, butanol, rượu benzyl, glycerol, propylen glycol, polyetylen glycol, N-metyl-pyrrolidon, 2-pyrrolidon, và hỗn hợp của chúng.

(Các) thành phần hoạt tính có thể được hòa tan tùy ý trong các dầu thực vật hoặc tổng hợp có thể chịu được về sinh lý mà thích hợp để tiêm.

Các chất làm tan thích hợp là các dung môi thúc đẩy sự hòa tan của thành phần hoạt tính trong dung môi chính hoặc ngăn chặn sự kết tủa của nó. Các ví dụ là polyvinylpyrrolidon, rượu polyvinyl, dầu thầu dầu polyoxyetyl hóa, và este sorbitan polyoxyetyl hóa.

Các chất bảo quản thích hợp là rượu benzyl, triclobutanol, este axit p-hydroxybenzoic, và n-butanol.

Dung dịch dùng qua đường miệng được sử dụng trực tiếp. Chất cô được sử dụng qua đường miệng sau khi pha loãng trước tới nồng độ sử dụng. Dung dịch dùng qua đường miệng và chất cô được điều chế theo trạng thái của lĩnh vực và như được mô tả ở trên cho dung dịch tiêm, các phương pháp khô không cần thiết.

Dung dịch để dùng trên da được chảy trên, lan truyền trên, cọ xát vào, rắc lên trên hoặc được phun lên.

Dung dịch để dùng trên da được điều chế theo trạng thái của lĩnh vực và theo như được mô tả ở trên cho dung dịch tiêm, các phương pháp khô không cần thiết.

Nói chung, "lượng tác dụng chống lại vật ký sinh" có nghĩa là lượng thành phần hoạt tính cần để đạt được tác dụng có thể quan sát với sự sinh trưởng, bao gồm hiệu quả về bệnh hoại tử, sự chết, sự làm chậm, sự phòng bệnh, và sự loại bỏ, sự phá hoại, hoặc theo cách khác làm giảm sự xuất hiện và hoạt tính của sinh vật đích. Lượng tác dụng chống lại vật ký sinh có thể thay đổi với các hợp chất/chế phẩm khác nhau dùng theo sáng chế. Lượng tác dụng chống lại vật ký sinh của các chế phẩm cũng sẽ thay đổi theo điều kiện hiện tại như tác dụng và khoảng thời gian diệt ký sinh trùng mong muốn, loài đích, cách thức sử dụng, và tương tự.

Các chế phẩm có thể sử dụng theo sáng chế nhìn chung có thể chứa từ khoảng 0,001 đến 95% hợp chất có công thức (I).

Nhìn chung thuận lợi sử dụng hợp chất có công thức (I) với tổng lượng từ 0,5 mg/kg đến 100 mg/kg tính theo ngày, tốt hơn là nằm trong khoảng 1 mg/kg đến 50 mg/kg tính theo ngày.

Các chế phẩm có sẵn để sử dụng chứa hợp chất hoạt động chống lại vật ký sinh, tốt hơn là vật ngoại ký sinh, ở nồng độ từ 10 ppm đến 80 phần trăm khối lượng, tốt hơn là từ 0,1 đến 65 phần trăm khối lượng, tốt hơn nữa là từ 1 đến 50 phần trăm khối lượng, càng tốt hơn là từ 5 đến 40 phần trăm khối lượng.

Các chế phẩm được pha loãng trước khi dùng chứa hợp chất hoạt động chống lại vật ngoại ký sinh ở nồng độ từ 0,5 đến 90 phần trăm khối lượng, tốt hơn là từ 1 đến 50 phần trăm khối lượng.

Ngoài ra, các chế phẩm chứa hợp chất có công thức (I) chống lại vật nội ký sinh ở nồng độ từ 10 ppm đến 2 phần trăm khối lượng, tốt hơn là từ 0,05 đến 0,9 phần trăm khối lượng, cụ thể là tốt hơn là từ 0,005 đến 0,25 phần trăm khối lượng.

Theo phương án ưu tiên theo sáng chế, các chế phẩm chứa hợp chất có công thức (I) được dùng qua da / tại chỗ.

Theo phương án ưu tiên khác, việc sử dụng tại chỗ được tiến hành dưới dạng sản phẩm được tạo hình chứa hợp chất như đai, huy chương, thẻ tai, băng để cố định ở các bộ phận cơ thể, và các loại băng và lá dính.

Nhìn chung sẽ thuận lợi để sử dụng các chế phẩm rắn mà giải phóng hợp chất có

công thức (I) với tổng lượng từ 10 mg/kg đến 300 mg/kg, tốt hơn là từ 20 mg/kg đến 200 mg/kg, càng tốt hơn là từ 25 mg/kg đến 160 mg/kg trọng lượng cơ thể của động vật được xử lý trong khoảng thời gian ba tuần.

Để chuẩn bị sản phẩm được tạo hình, nhiệt dẻo và chất dẻo linh hoạt cũng như chất đàn hồi và chất đàn hồi nhiệt dẻo được dùng. Chất dẻo và chất đàn hồi thích hợp là nhựa polyvinyl, polyurethan, polyacrylat, nhựa epoxy, xenluloza, dẫn xuất xenluloza, polyamit và polyeste tương thích đủ với hợp chất có công thức (I). Danh sách chất dẻo và chất đàn hồi chi tiết cũng như các quy trình chuẩn bị sản phẩm được tạo hình được đưa ra trong WO 03/086075 chẳng hạn.

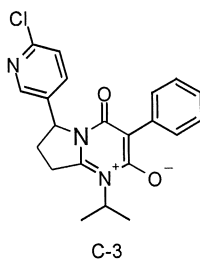
Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế hiện được minh họa chi tiết hơn bằng các ví dụ sau, mà không giới hạn ở các ví dụ này.

S. Các ví dụ tổng hợp

Ví dụ 1: Quá trình tổng hợp S1

Quá trình tổng hợp của ví dụ được đánh số C-3: 6-(6-clo-3-pyridyl)-1-isopropyl-3-methyl-4-oxo-7,8-dihydro-6H-pyrrolo[1,2-a]pyrimidin-1-ium-2-olat



Bước 1.1: 6-clo-3-pyridyl) metanol

Bổ sung nhỏ giọt dung dịch axit 6-clopyridin-3-cacboxylic (50 g, 0,323 mol) vào dung dịch LiAlH_4 (25 g, 0,65 mol) trong THF (1500 ml) trong THF ở 0°C , và hỗn hợp được khuấy trong 3 giờ ở 0°C . THF và $\text{Na}_2\text{SO}_4 \times 5\text{H}_2\text{O}$ được bổ sung từ từ. Sau khi khuấy trong 20 phút, hỗn hợp được lọc và dịch lọc được cô đặc để thu được sản phẩm thô (26 g, hiệu suất: 57,1%).

Bước 1.2: 6-clopyridin-3-carbaldehyt

Bổ sung nhỏ giọt sản phẩm của bước trên (26 g, 0,184mol) ở dạng dung dịch trong DCM vào dung dịch PCC (58 g, 0,27 mol) trong DCM (1500 ml) ở 0°C. Hỗn hợp sau đó được khuấy trong 2 giờ ở 20°C. Hỗn hợp được lọc qua đất tảo silic và các thành phần lọc được rửa sạch bằng DCM. Pha hữu cơ được cô đặc để thu được sản phẩm thô, được tinh chế bởi sắc ký cột để thu sản phẩm (15 g, hiệu suất: 60,1%).

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 10,067 (s, 1H), 8,874 (s, 1H, $J=3\text{Hz}$), 8,158~8,138 (d, 1H, $J=8\text{Hz}$), 7,534~7,513 (d, 1H, $J=8\text{Hz}$)

Bước 1.3: Metyl 4-(6-clo-3-pyridyl)-4-oxo-butanoat

Bổ sung NaCN (0,7 g, 14 mmol) vào dung dịch 6-clopyridin-3-carbaldehyt (10 g, 70 mmol) trong DMF (40 ml). Hỗn hợp được khuấy trong 1 giờ sau đó bổ sung nhỏ giọt metyl acrylat (5,2 g, 60 mmol). Tiếp tục khuấy trong 3 giờ ở nhiệt độ phòng, dung dịch được rót vào nước, và được chiết bằng EtOAc. Pha hữu cơ được sấy khô, được lọc và được cô đặc để thu được metyl 4-(6-clo-3-pyridyl)-4-oxo-butanoat (6,8 g, hiệu suất: 42,5%).

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 8,971~8,968 (m, 1H), 8,219~8,198 (d, 1H, $J=8,4\text{Hz}$), 7,462~7,441 (d, 1H, $J=8,4\text{Hz}$), 3,710 (s, 3H), 3,306~3,274 (m, 1H) 2,812~2,760 (m, 2H).

Bước 1.4: 5-(6-clo-3-pyridyl) pyrrolidin-2-on

Bổ sung NH_4OAc (6,8 g, 88,3 mmol) và NaBH_3CN (5,6 g, 88,3 mmol) vào dung dịch metyl 4-(6-clo-3-pyridyl)-4-oxo-butanoat (6,7 g, 29,5 mmol) trong MeOH (100 ml), và hỗn hợp được hồi lưu qua đêm. Dung môi được loại bỏ *trong chân không*, phần còn lại được hòa tan trong DCM, được rửa bằng nước muối, sấy khô, và được cô đặc để thu sản phẩm thô. Tinh chế bằng sắc ký cột thu được sản phẩm (3 g, hiệu suất: 51,9%).

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 8,336~8,330 (d, 1H, $J=2,4\text{Hz}$), 7,642~7,616 (m, 1H), 7,361~7,340 (d, 1H, $J=8,4\text{Hz}$), 6,987 (s, 1H), 4,819~4,782 (m, 1H), 2,634~2,482 (m, 1H), 2,474~2,432 (m, 2H), 1,967~1,935 (m, 1H).

Bước 1.5: 5-(6-clo-3-pyridyl) pyrrolidin-2-thion

Bổ sung P_2S_5 (3,3 g, 14,7 mmol) vào dung dịch chứa hợp chất từ bước trên (2,4

g, 12,24 mmol) trong dioxan (150 ml) ở RT. Hỗn hợp được gia nhiệt đến 110°C và được khuấy trong 2,0 giờ. Sau khi lọc nóng hỗn hợp, dịch lọc được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (1,56 g, hiệu suất: 60,2%).

Bước 1.6: 2-clo-5-(5-metylsulfanyl-3,4-dihydro-2H-pyrrol-2-yl)pyridin

Bổ sung K₂CO₃ vào dung dịch 5-(6-clo-3-pyridyl) pyrrolidin-2-thion (2 g, 9,4 mmol) trong axeton (100 ml). Sau khi khuấy ở RT trong 30 phút, iodometan được bổ sung và được khuấy trong 3 giờ nữa ở nhiệt độ phòng. Sau khi lọc, dịch lọc được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (2,1 g, hiệu suất: 97,6%).

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ 8,320 (s, 1H), 7,564~7,544 (d, 1H, *J*=8,0Hz), 7,298~7,278 (d, 1H, *J*=8,0Hz), 5,105~5,068 (m, 1H), 2,856~2,792 (m, 2H), 2,634~2,513 (m, 2H), 2,179 (s, 3H), 1,820~1,255 (m, 1H).

Bước 1.7: 2-(6-clo-3-pyridyl)-N-isopropyl-3,4-dihydro-2H-pyrrol-5-amin

Bổ sung isopropyl amin (580 mg, 10,3mmol) vào sản phẩm từ bước 6 (0,25g, 1,03 mmol) trong THF (30 ml) và hỗn hợp được gia nhiệt trong ống kín ở 130°C qua đêm. Làm mát tới 20°C dung môi được loại bỏ *trong chân không*. Phần còn lại được hòa tan trong EtOAc (60 mL), được rửa sạch bằng nước (30 mL), nước muối, và được cô đặc để thu được sản phẩm (230 mg, hiệu suất: 88,1%).

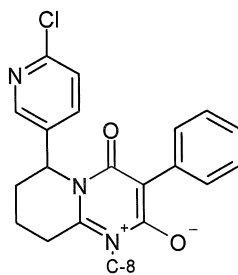
Bước 1.8: 3-(6-clo-3-pyridyl)-8-(dimetylamino)-5-oxo-6-phenyl-1,2,3,8-tetrahydroindolizin-4-ium-7-olat.

Sản phẩm từ bước 7 (0,23 g, 0,96 mmol) và bis(2,4,6-triclophenyl) 2-phenylpropandioat (0,62 g, 1,2 mmol) được xử lý trong toluen (5 ml) với một vài giọt DMF. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt trong lò vi sóng ở 150°C trong 90 phút. Sau khi làm mát tới RT, hỗn hợp này được rót vào nước (10ml), và được chiết bằng EtOAc (45mL). Pha hữu cơ được làm khô bằng Na₂SO₄, và được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (0,155 g, hiệu suất: 57,8%).

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ 8,400~8,394 (d, 1H, *J*=2,4Hz), 7,8818~7,791 (m, 1H), 7,470~7,395 (m, 3H), 7,285~7,142 (m, 3H), 5,841~5,807 (m, 1H), 3,771~3,608 (m, 2H), 2,982~2,869 (m, 2H), 2,249~2,192 (m, 1H), 1,722~1,671 (m, 6H).

Ví dụ 2: Quy trình tổng hợp S2

Quy trình tổng hợp của ví dụ được đánh số C-8: 6-(6-clo-3-pyridyl)-1-metyl-4-oxo-3-phenyl-6,7,8,9-tetrahydropyrido[1,2-a]pyrimidin-5-ium-2-olat



Bước 2.1: Metyl 5-(6-clo-3-pyridyl)-5-oxo-pentanoat

Bổ sung 0,2 ml TMSCl trong môi trường khí argon ở 60°C được khuấy trong 5 phút vào hỗn hợp kim loại Zn (21,7 g, 0,339 mol) và DMI (38,6 g, 0,339 mol) trong MeCN (300 mL), sau đó bổ sung metyl 4-iodo butanoat (58 g, 0,254 mol). Hỗn hợp được khuấy trong 2 giờ ở nhiệt độ này, và sau đó làm mát tới nhiệt độ phòng. Dung dịch này được dùng trực tiếp.

Bổ sung chất thử alkyl kẽm trong môi trường khí argon vào hỗn hợp 6-clopyridin-3-cacbonyl clorua (14,8 g, 0,085 mol) và Pd(OAc)₂ (0,57 g, 0,00254 mol) trong MeCN (300 mL) và khuấy ở nhiệt độ phòng. Sau 2 giờ, dung dịch NH₄Cl bão hòa được bổ sung vào hỗn hợp phản ứng và được chiết bằng EtOAc. Các pha hữu cơ được kết hợp, được rửa sạch bằng nước muối, sấy khô, được lọc và được cô đặc để thu được sản phẩm thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (9,5 g).

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ d 8,88~8,89 (d, 1H, J=2Hz), 8,13~8,19 (m, 1H), 7,36~7,40 (d, 1H, J=16Hz), 4,03~4,01 (q, 2H), 2,98~3,02 (t, 2H, J=6,8Hz) 2,37~2,407 (t, 2H, J=7,2Hz), 1,98~2,05 (m, 2H), 1,15~1,22 (t, 2H, J=13Hz).

Bước 2.2: 6-(6-clo-3-pyridyl) piperidin-2-on

Bổ sung NH₄OAc (6,1g, 78,8mmol) và NaBH₃CN (5 g, 78,8 mmol) vào dung dịch metyl 5-(6-clo-3-pyridyl)-5-oxo-pentanoat (9,5g, 39,4 mmol) trong MeOH (150 ml), và hỗn hợp được hồi lưu qua đêm. Làm mát tới RT, dung môi được loại bỏ *trong chân không*, chất cặn được hòa tan trong DCM, được rửa sạch bằng nước muối, cô đặc đến khô để thu được sản phẩm thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh

khiết (5g, hiệu suất: 61%).

Bước 2.3: 6-(6-clo-3-pyridyl)piperidin-2-thion

Bổ sung P_2S_5 (2,8 g, 12,6 mmol) vào dung dịch 6-(6-clo-3-pyridyl)piperidin-2-on (2,2 g, 10,4 mmol) trong dioxan (150 ml) ở 20°C. Hỗn hợp được khuấy trong 2,5 giờ ở 120°C. Sau khi lọc nóng hỗn hợp, dịch lọc được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (1,5 g, hiệu suất: 63,5%).

Bước 2.4: 2-clo-5-(6-metylsulfanyl-2,3,4,5-tetrahydropyridin-2-yl)pyridin

Bổ sung K_2CO_3 vào dung dịch 6-(6-clo-3-pyridyl)piperidine-2-thion (1,5 g, 6,64 mmol) trong axeton (120 ml) và khuấy trong 30 phút, sau đó iodo metan (1,42 g, 9,96 mmol) được bổ sung và được khuấy qua đêm ở 20°C. Sau khi lọc, dịch lọc được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm tinh khiết (1,2 g, hiệu suất: 75,3%).

Bước 2.5: 2-(6-clo-3-pyridyl)-N-metyl-2,3,4,5-tetrahydropyridin-6-amin

2-clo-5-(6-metylsulfanyl-2,3,4,5-tetrahydropyridin-2-yl)pyridin (0,6 g, 2,5 mmol) được xử lý trong metyl amin (20 mL, 40 mmol), và hỗn hợp được gia nhiệt trong ống kín ở 80°C qua đêm. Làm mát tới 20°C dung môi được loại bỏ *trong chân không*, phần còn lại được hòa tan trong EtOAc (60 mL) và được rửa sạch bằng nước (30 mL), và nước muối. Pha hữu cơ được cô đặc để thu được sản phẩm (480 mg, thô).

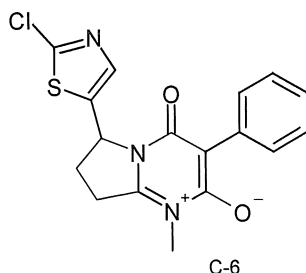
Bước 2.6: 6-(6-clo-3-pyridyl)-1-metyl-4-oxo-3-phenyl-6,7,8,9-tetrahydropyrido[1,2-a]pyrimidin-5-ium-2-olat

Sản phẩm từ bước trên (0,48 g, thô) và bis(2,4,6-triclophenyl) 2-phenylpropandioat (1,4 g, 2,4 mmol) được xử lý trong toluen (5 ml) bằng một vài giọt DMF. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt trong lò vi sóng ở 150°C trong 90 phút. Sau khi làm mát tới RT, hỗn hợp được rót vào nước (10ml), và được chiết bằng EtOAc (45mL). Pha hữu cơ được làm khô bằng Na_2SO_4 , và được cô đặc để thu được chất thô. Tinh chế bằng sắc ký cột tạo ra sản phẩm tinh khiết (0,4 g, hiệu suất: 50,7%).

1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ d 8,381~8,375 (d, 1H, $J=2,4Hz$), 7,818~7,791 (m, 1H), 7,552~7,485 (m, 3H), 7,207~7,048 (m, 3H), 5,941~5,933 (s, 1H), 3,495 (s, 3H), 3,236~3,174 (m, 2H), 2,179~2,132 (m, 2H), 1,822~1,426 (m, 2H).

Ví dụ 3: Quy trình tổng hợp S3

Quy trình tổng hợp của ví dụ được đánh số C-6: 6-(2-clothiazol-5-yl)-1-metyl-4-oxo-3-phenyl-3,6,7,8-tetrahydro-2H-pyrrolo[1,2-a]pyrimidin-5-ium-2-olat



Hỗn hợp 2-(2-clothiazol-5-yl)-N-metyl-3,4-dihydro-2H-pyrrol-5-amin (230 mg, 1,07 mmol) và bis(2,4,6-triclophenyl) 2-phenylpropanedioat (632 mg, 1,17 mmol) trong toluen (10 ml) trong ống kín được gia nhiệt ở 150°C trong 90 phút trong điều kiện chiếu xạ vi sóng. Làm mát tới RT, hỗn hợp thu được được cô đặc, và phần còn lại được tinh chế bằng TLC điều chế để thu được 6-(2-clothiazol-5-yl)-1-metyl-4-oxo-3-phenyl-3,6,7,8-tetrahydro-2H-pyrrolo[1,2-a]pyrimidin-5-ium-2-olat (90 mg, hiệu suất: 23%) ở dạng chất rắn màu vàng.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ d 7,87 (s, 1H), 7,60 (d, 2H, J=7,2 Hz), 7,23 (t, 2H, J=7,6 Hz), 7,08 (t, 1H, J=7,6 Hz), 5,98~5,95 (m, 1H), 3,67~3,59 (m, 1H), 3,51~3,44 (m, 1H), 3,37 (s, 3H), 2,69~2,67 (m, 1H), 2,60~2,54 (m, 1H).

Hợp chất nhìn chung có thể được đặc trưng ví dụ bằng sắc ký lỏng hiệu năng cao / khối phổ (High Performance Liquid Chromatography / mass spectrometry - HPLC/MS) được ghép, bằng ¹H-NMR và/hoặc bằng điểm nóng chảy của chúng.

Điều kiện:

Cột HPLC phân tích 1: cột RP-18 Chromolith Speed ROD từ Merck KGaA, Germany). Dung dịch rửa: axetonitril + 0,1% axit trifloaxetic (TFA) / nước + 0,1% axit trifloaxetic (TFA) với tỷ lệ nằm trong khoảng từ 5:95 tới 95:5 trong 5 phút ở 40°C.

r.t. = thời gian giữ lại (retention time - RT) HPLC trên phút; m/z của các đỉnh [M+H]⁺, [M+Na]⁺ hoặc [M+K]⁺.

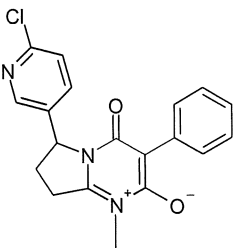
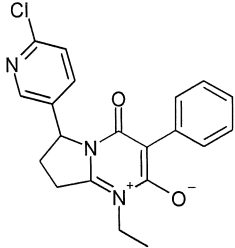
Cột HPLC phân tích 2: Phenomenex Kinetex 1,7μm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm

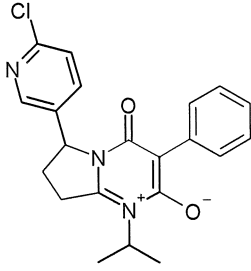
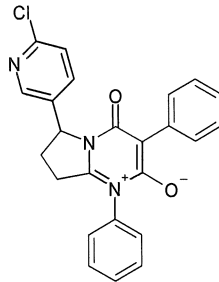
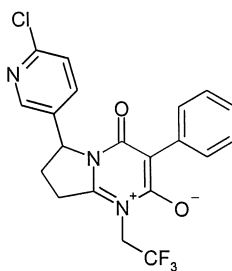
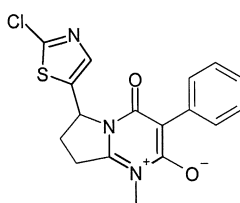
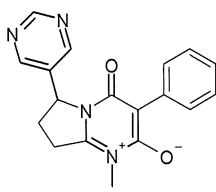
Dung dịch rửa: A: axetonitril + 0,1% axit trifloaxetic (TFA) / nước + 0,1% axit trifloaxetic (TFA) với tỷ lệ nằm trong khoảng từ 5:95 tới 95:5 trong 1,5 phút ở 50 °C.

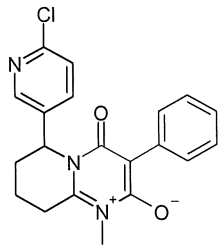
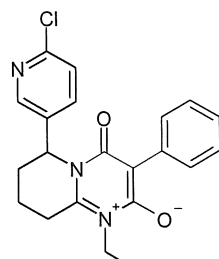
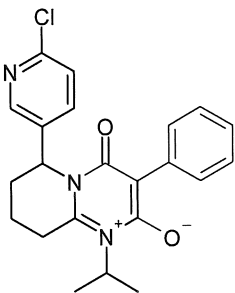
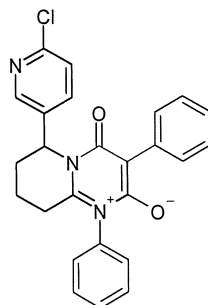
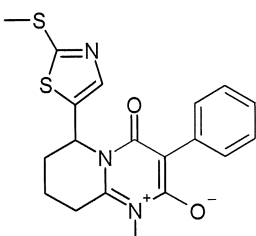
Phương pháp MS: ESI dương.

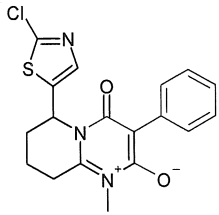
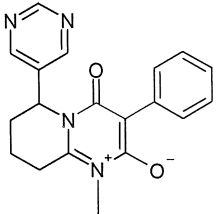
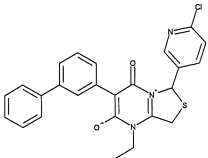
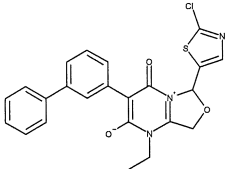
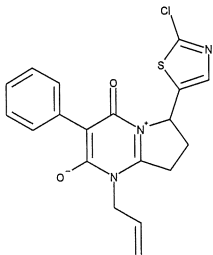
^1H -NMR, tương ứng ^{13}C -NMR: Các tín hiệu được mô tả đặc trưng bằng chuyển dịch hóa học δ (ppm) so với tetrametylsilan, tương ứng CDCl_3 với ^{13}C -NMR, bằng bội số của chúng và bằng tích phân của chúng (tùy theo số nguyên tử hydro đã cho). Các chữ viết tắt sau được dùng để mô tả đặc trưng bội số của các tín hiệu: m = đa vạch, q = bốn vạch, t = ba vạch, d = hai vạch và s = một vạch. Hằng số ghép cặp (J) được biểu thị theo Hertz (Hz).

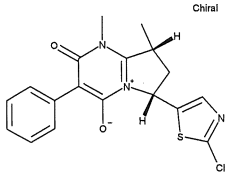
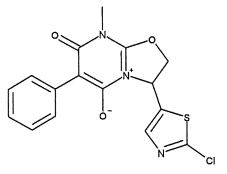
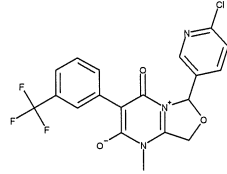
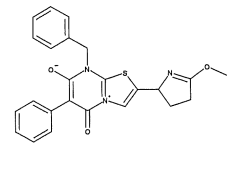
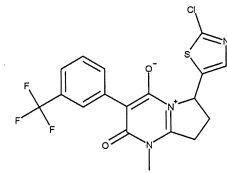
Các hợp chất khác các ví dụ thực hiện sáng chế được điều chế giống với phương pháp tổng hợp được mô tả ở trên và bảng minh họa dưới đây, mà không giới hạn ở, hợp chất các ví dụ có công thức (I) bao gồm dữ liệu mô tả đặc điểm tương ứng của chúng:

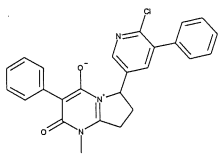
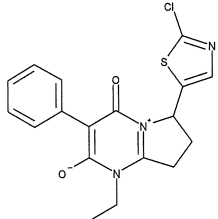
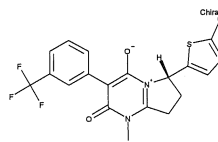
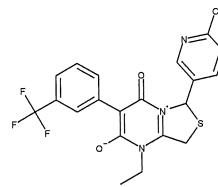
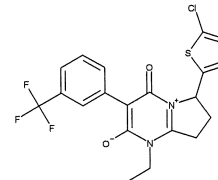
Số	Công thức	Đặc tính ^1H -NMR và/hoặc HPLC/MS $\delta(\text{ppm})$; J (Hz)
C-1		CDCl_3 : 8,26(s, 1H), 7,54~7,53 (d, 1H), 7,52~7,51 (d, 1H), 7,31~7,26 (t, 2H), 7,16~7,13 (t, 1H), 5,77~5,74 (d, 1H), 3,47 (s, 3H), 3,33~2,24 (m, 1H), 3,15~3,07 (m, 1H), 2,68~2,58 (m, 1H), 2,13~2,05(m, 1H),
C-2		MeOD: 8,408~8,402 (d, 1H, J=2,4Hz), 7,825~7,798 (m, 1H), 7,470~7,427 (m, 3H), 7,289~7,147 (m, 3H), 5,860~5,827 (m, 1H), 4,272~4,219 (m, 1H), 4,056~4,022 (m, 1H), 3,763~3,310 (m, 2H), 2,959~2,922 (m, 1H), 2,270~2,213 (m, 1H), 1,444~1,408 (m, 1H).

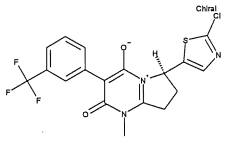
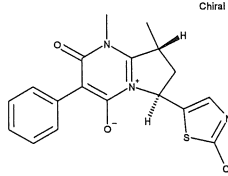
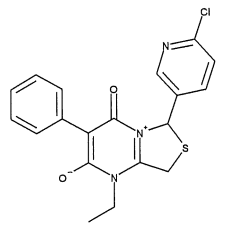
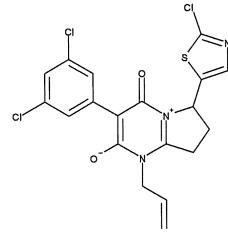
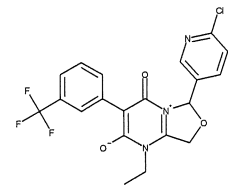
C-3		MeOD: 8,400~8,394 (d, 1H, J=2,4Hz), 7,8818~7,791 (m, 1H), 7,470~7,395 (m, 3H), 7,285~7,142 (m, 3H), 5,841~5,807(m, 1H), 3,771~3,608 (m, 2H), 2,982~2,869 (m, 2H), 2,249~2,192 (m, 1H), 1,722~1,671 (m, 6H)
C-4		MeOD: 8,495~8,489 (d, 1H, J=2,4), 7,921~7,914 (d, 1H, J=2,8), 7,622~7,594 (m, 4H), 7,494~7,475 (m, 4H), 7,278~7,135 (m, 3H), 5,918~5,884 (m, 1H), 3,341~3,098 (m, 1H), 3,084~3,072 (m, 1H), 2,854~2,802 (m, 1H), 2,168~2,161 (m, 1H)
C-5		MeOD: 8,412~8,406 (d, 1H, J=2,4), 7,820~7,793 (m, 1H), 7,486~7,436 (m, 3H), 7,293~7,156 (m, 3H), 5,929~5,897 (m, 1H), 5,136~4,886 (m, 2H), 3,796~3,610 (m, 2H), 2,915~2,512 (m, 2H)
C-6		DMSO-D ₆ : 7,87 (s, 1H), 7,60 (d, 2H, J=7,2), 7,23 (t, 2H, J=7,6), 7,08 (t, 1H, J=7,6), 5,98~5,95 (m, 1H), 3,67~3,59 (m, 1H), 3,51~3,44 (m, 1H), 3,37 (s, 3H), 2,69~2,67 (m, 1H), 2,60~2,54 (m, 1H)
C-7		CDCl ₃ : 9,10(s, 1H), 8,60 (s, 2H), 7,63 (d, 2H, J=7,6), 7,24 (t, 2H, J=7,8), 7,09 (t, 1H, J=7,8), 5,72~5,68 (m, 1H), 3,42 (s, 3H), 3,28~3,21 (m, 1H), 3,11~3,08 (m, 1H), 2,62~2,56 (m, 1H), 2,10~2,06 (m, 1H)

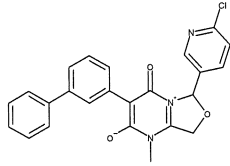
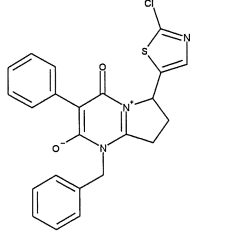
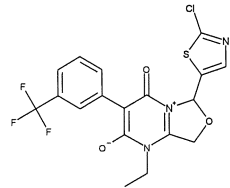
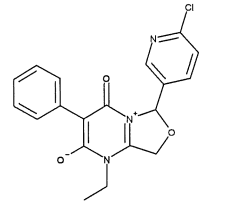
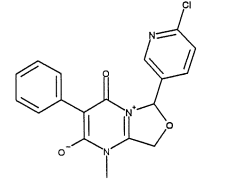
C-8		DMSO: 8,381~8,375 (d, 1H, J=2,4), 7,818~7,791 (m, 1H), 7,552~7,485 (m, 3H), 7,207~7,048 (m, 3H), 5,941~5,933 (s, 1H), 3,495 (s, 3H), 3,236~3,174 (m, 2H), 2,179~2,132 (m, 2H), 1,822~1,426 (m, 2H)
C-9		DMSO: 8,363~8,357 (d, 1H, J=2,4), 7,787~7,760 (m, 1H), 7,564~7,460 (m, 3H), 7,207~7,050 (m, 3H), 5,938 (s, 1H), 4,252~4,007 (m, 2H), 3,364~3,155 (m, 2H), 2,239~1,828 (m, 3H), 1,500~1,473 (m, 1H) 1,309~1,274 (m, 3H)
C-10		MeOD: 8,261~8,255(d, 1H, J=2,4), 7,670~7,117 (m, 7H), 6,045 (s, 1H), 3,333~3,222 (m, 2H), 2,288~2,178(m, 3H), 1,932~1,922 (d, 2H, J=4,0), 1,723~1,657 (m, 6H)
C-11		DMSO: 8,511~8,506 (d, 1H, J=2,0), 7,943~7,040 (m, 12H), 5,976 (s, 1H), 2,583 (s, 2H), 2,235~1,354 (m, 4H)
C-12		CDCl ₃ : 7,66~7,62 (d, 2H), 7,27~7,21 (m, 2H), 7,11~7,08 (t, 1H), 6,34 (s, 1H), 3,47 (s, 3H), 2,90~2,86 (d, 1H), 2,76~2,70 (m, 1H), 2,57 (s, 3H), 2,22~2,20 (d, 1H), 1,94 (s, 3H),

C-13		CDCl ₃ : 7,65~7,59 (d, 2H, J=7,6), 7,29~7,22 (m, 2H), 7,13~7,10 (t, 1H), 6,31 (m, 1H), 3,52 (s, 3H), 2,99~2,93 (m, 1H), 2,83~2,76 (m, 1H), 2,33~2,30 (m, 1H), 2,02~2,00 (m, 1H)
C-14		CDCl ₃ : 9,13(s, 1H), 8,51 (s, 2H), 7,65~7,63 (d, 2H, J=7,6), 7,31~7,27 (t, 2H, J=7,6), 7,16~7,13 (t, 1H, J=7,6), 6,10 (m, 1H), 3,56 (s, 3H), 3,00~2,93 (m, 1H), 2,82~2,75 (m, 1H), 2,12~2,10 (m, 2H), 1,92~1,86 (m, 1H), 1,62~1,56 (m, 1H)
C-15		HPLC/MS RT 1,106 phút m/z 462,7 ¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,45(s,1H),7,90(s,1H),7,70(d,1H),7,65(t,1H),7,60(d,2H),7,40(t,4H),7,35(t,2H),6,95(s,1H),4,80(d,1H),4,60(d,1H),4,40-4,25(m,1H),4,05-3,95(m,1H),1,45(t,3H)
C-16		HPLC/MS RT 1,126 phút m/z 452,6 ¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,95(s,1H),7,75(s,1H),7,70-7,65(m,1H),7,60(d,2H),7,50-7,40(m,4H),7,30(t,1H),7,20(s,1H),5,45(dd,1H),5,35(dd,1H),4,00-3,90(m,1H),3,90-3,80(m,1H),1,40(t,3H)
C-17		HPLC/MS RT 0,9 phút m/z 385,3 ¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,75(d,2H),7,50(s,1H),7,35(t,2H),7,20(t,1H),6,00(d,1H),5,95-

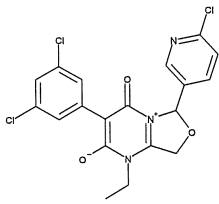
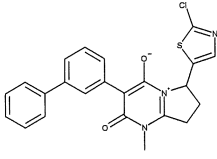
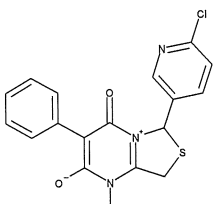
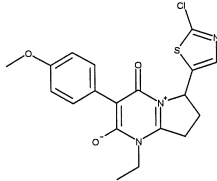
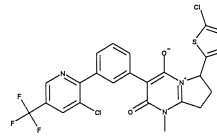
		5,80(m,1H),5,30(d,1H),5,20(d,1H),4,60(dd,1H),4,45(dd,1H),3,40-3,30(m,1H),3,20(q,1H),2,62-2,50(m,1H),2,45(q,1H)
C-18		¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) raxemic 7,62(d,2H),7,57(s,1H),7,35(t,2H),7,20(t,1H),6,02(q,1H),3,85(q,1H),3,60(s,3H),2,80-2,70(m,1H),2,60-2,40(m,1H),1,59(d,3H)
C-19		¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) 7,71(s,1H),7,53(d,2H),7,42(t,2H),7,34(t,1H),5,91(dd,1H),4,95(t,1H),4,81(dd,1H),3,36(s,3H)
C-20		HPLC-MS RT 0,969 phút m/z 423,8 ¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(s,1H),8,00(s,1H),7,85(d,2H),7,45(d,2H),7,40(d,1H),7,05(s,1H),5,45(d,1H),5,35(d,1H),3,45(s,3H), 1,65(s(breit),1H)
C-21		HPLC-MS RT 0,891 phút m/z 432,3 ¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,75(d,2H),7,40-7,30(m,5H),7,23(d,2H),7,15(t,1H),6,75(s,1H),5,75(d,1H),5,30(d,1H),5,05(d,1H),3,20(s,3H)3,10-3,00(m,2H),2,45-2,30(m,1H),2,15-2,10(m,1H)
C-22		¹ H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) 8,08(s,1H),7,98(d,1H),7,55(s,1H),7,48-7,43(m,2H),6,04(d,1H),3,46(s,3H),3,50-3,44(m,1H),3,32-3,25(m,1H),2,71-2,68(m,1H),2,61-2,56(m,1H)

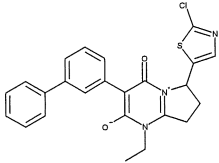
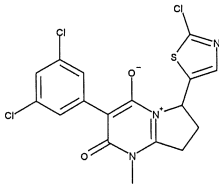
C-23		$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{ppm}/400\text{MHz})$ 8,29(d,1H),7,71(d,2H),7,52(d,1H),7,44(d,5H), 7,34- 7,30(m,2H),7,18(t,1H),5,85(dd,1H),3,50(s,3H) ,3,38-3,31(m,1H),3,22-3,19(m,1H),2,75- 2,69(m,1H),2,21-2,15(m,1H)
C-24		HPLC/MS RT 0,846 phút m/z 373,8 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{ppm})$ 7,70(d,2H),7,55(s,1H),7,35(d,2H),7,2(d,1H),6, 05(d,1H),4,00(q,2H),3,44-3,40(m,1H),3,25- 3,20(m,1H),2,65-2,60(m,1H),2,60- 2,50(m,1H), 1,66(s(breit),1H),1,37(d,3H)
C-25		Chất đồng phân đối ảnh rửa giải thứ nhất (-) HPLC/MS RT 0,98 phút m/z 428,6
C-26		HPLC-MS RT 1,079 phút m/z 454,6 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{ppm})$ 8,40(d,1H),7,98(s,1H),7,85(t,1H),7,70(dd,1H), 7,40(d,2H),7,30(d,1H)6,85(s,1H),4,75(dd,1H), 4,45(d,1H)4,25-4,15(m,1H),3,90- 3,80(m,1H),1,35(t,3H)
C-27		HPLC/MS RT 1,042 phút m/z 442,6 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{ppm})$ 8,10(s,1H),7,95(d,1H),7,55(s,1H),7,45(q,2H), 6,10(d,1H),4,15-4,05(m,1H),4,00- 3,90(m,1H),3,60-3,50(m,1H),3,40(q,1H),2,85- 2,75(m,1H),2,65(q,1H),1,40(t,3H)

C-28		Chất đồng phân đối ảnh rửa giải thứ hai HPLC-MS RT 0,982 phút m/z 428,6
C-29		H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) raxemic 7,65(d,2H),7,55(s,1H),7,35(t,2H),7,25(t,1H),6,05(d,1H),3,60-3,45(m,1H),3,50(s,3H), 3,00-2,90(m,1H),2,35(d,1H),1,55(d,3H) LC-MS RT 1,073 phút m/z 374,2
C-30		HPLC-MS RT 0,891 phút m/z 386,5 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,45(d,1H),7,75(dd,1H),7,35(d,2H),7,30(t,H),7,15(t,1H),6,95(s,1H),4,80(d,1H),4,60(d,1H),4,35-4,35(m,1H),4,05-3,95(m,1H),1,50(t,3H)
C-31		HPLC/MS RT 1,173 phút m/z 455,2 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,75(s,2H),7,55(s,1H),7,15(s,1H),6,10(d,1H),6,00-5,85(m,1H),5,35(d,1H),5,25(d,1H),4,70-4,55(m,2H), 3,60-3,45(m,1H), 3,40(q,1H),2,85-2,70(m,1H),2,65(q,1H),1,60(s,1H)
C-32		HPLC/MS RT 1,025 phút m/z 437,8 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(s,1H),8,00(s,1H),7,90-7,80(m,2H),7,45-7,35(m,3H),7,05(s,1H),5,55-5,45(m,1H),5,45-5,40(m,1H),4,15-4,00(m,1H),3,90-3,80(m,1H),1,45(t,3H)

C-33		HPLC-MS RT 1,006 phút m/z 431,8 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(s,1H),7,90(d,2H),7,65(d,1H),7,60(d,2H), 7,40(d,3H),7,35(d,2H),7,30(t,1H),7,00(s,1H),5 ,40(d,1H),5,30(d,1H),3,45(s,3H)
C-34		HPLC/MS RT 1,014 phút m/z 436,2 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,75(d,2H),7,45(s,1H),7,40- 7,30(m,6H),7,28(d,1H),7,20(t,1H),5,95(d,1H), 5,25(d,1H),5,05(d,1H),3,25-3,05(m,2H), 2,55- 2,40(m,1H), 2,35(q,1H),1,70(s(breit),1H)
C-35		HPLC/MS RT 0,969 phút m/z 443,8 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,05(s,1H),7,95(d,1H),7,75(s,1H),7,45(d,2H), 7,20(s,1H),5,40(q,2H),3,95-3,85(m,1H),3,85- 3,70(m,1H),1,20(t,3H)
C-36		HPLC-MS RT 0,848 phút m/z 369,7 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(d,1H),7,95(dd,1H),7,65(d,2H),7,35(d,1H) ,7,30(t,1H),7,25(s,3H),7,20(t,1H),7,10(s,1H), 5,50(d,1H),5,40(d,1H),4,10-3,95(m,1H),3,90- 3,80(m,1H),1,45(t,3H)
C-37		HPLC-MS RT 0,792 phút m/z 356,6 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(d,1H),7,90(dd,1H),7,65(d,2H),7,35(t,3H) ,7,20(t,1H),6,95(s,1H),5,30(d,1H),5,15(d,1H), 3,35(s,3H), 1,65(s(breit),1H)

C-38		H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) 7,76(d,2H),7,54(s,1H),7,37(t,2H),7,21(t,1H),5,26(t,1H),4,96(q,1H),4,53(q,1H),3,49(s,3H)
C-39		Chất đồng phân đối ảnh rửa giải thứ nhất (-) HPLC/MS RT 0,797 phút m/z 360,5
C-40		HPLC-MS RT 1,180 phút m/z 388,1 H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) 7,70(d,2H),7,48(s,1H),7,33(t,2H),7,19(t,1H),5,86(d,1H),3,53(t,3H),2,57(q,1H),2,44(d,1H),1,53(dd,6H)
C-41		HPLC/MS RT 1,096 phút m/z 453,3 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,10(s,1H),7,90(d,1H),7,55(s,1H),7,45(q,2H),6,10(d,1H),6,00-5,80(m,1H),5,35(d,1H),5,25(d,1H),4,65-4,45(m,2H),3,60-3,40(m,1H),3,35(q,1H),2,80-2,62(m,1H),2,60(q,1H)
C-42		HPLC-MS RT 0,801 phút m/z 360,5
C-43		HPLC-MS RT 1,079 phút m/z 446,7 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(d,1H),7,90(d,2H),7,65-7,60(m,1H),7,60(d,2H),7,40(d,3H),7,35(d,2H),7,30(t,1H),7,05(s,1H),5,40(d,1H),5,30(d,1H),

		4,10-3,90(m,1H),3,90-3,80(m,1H),1,40(t,3H)
C-44		HPLC-MS RT 1,096 phút m/z 437,7 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 8,55(s,1H),7,90(dd,1H),7,65(s,2H),7,45(d,1H), , 7,10(s,1H),7,15(t,1H),5,55(d,1H),5,45(d,1H),4 ,15-4,05(m,1H),3,95-3,85(m,1H),1,45(t,3H)
C-45		HPLC-MS RT 0,792 phút m/z 436,1 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,99(s,1H),7,73- 7,72(m,1H),7,64(d,2H),7,50(s,1H),7,43(t,4H), 7,32(t,1H),6,01(d,1H),3,38(s,3H),3,46- 3,33(m,1H),3,18-3,11(m,1H),2,59-2,48(m,2H)
C-46		HPLC/MS RT 0,821 phút m/z 372,5 H-NMR(CDCl ₃ /ppm/500MHz) 8,45(d,1H),7,70(d,1H),7,60(d,2H),7,30- 7,25(m,3H),7,15(t,1H),6,90(s,1H),4,65(d,1H), 4,45(d,1H),3,55(s,3H)
C-47		HPLC/MS RT 0,842 phút m/z 404,5 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,65(d,2H),7,55(s,1H),6,90(d,2H),6,10(d,1H), 4,15-4,05(m,1H),4,00- 3,90(m,1H),3,80(s,3H),3,60- 3,45(m,1H),3,35(q,1H),2,80- 2,70(m,1H),2,65(q,1H),1,40(t,3H)
C-48		H-NMR(CDCl ₃ /ppm/400MHz) 8,81(s,1H),8,20(s,1H),8,00(s,1H),7,92(d,1H),7 ,59(d,1H),7,55(s,1H),7,47(t,1H),6,08(d,1H),3,

		52(s,3H),3,50-3,47(m,1H),3,38-3,34(m,1H),2,74-2,71(m,1H),2,68-2,66(m,1H)
C-49		HPLC/MS RT 1,068 phút m/z 450,6 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,98(s,1H),7,70(s,1H),7,60(d,2H),7,50(s,1H),7,40(d,3H),7,39(s,1H),7,30(t,1H),6,05(d,1H),3,95(q,2H),3,50-3,40(m,1H),3,22(q,1H),2,70-2,60(m,1H),2,52(t,1H),1,65(s(breit),1H),1,35(t,3H)
C-50		HPLC-MS RT 1,07 phút m/z 428,8 H-NMR(CDCl ₃ /ppm) 7,75(s,2H), 7,55(s,1H),7,20(t,1H),6,05(d,1H),5,30(s,1H),3,55-3,40(m,3H),3,25(q,1H),2,80-2,60(m,1H),2,60(q,1H)

Hoạt tính sinh học của hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được đánh giá trong các thử nghiệm sinh học như được mô tả sau đây.

Điều kiện chung: Nếu không có chỉ định cụ thể khác, hầu hết dung dịch thử nghiệm được điều chế như sau:

Hợp chất hoạt động được hòa tan ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp là 1:1 (thể tích:thể tích) nước cất: axeton. Dung dịch thử nghiệm được điều chế ở ngày sử dụng.

Dung dịch thử nghiệm được điều chế nói chung ở nồng độ là 2500 ppm, 1000 ppm, 500 ppm, 300 ppm, 100 ppm và 30 ppm (wt/vol).

Mọt trên cây bông (*Anthonomus grandis*)

Để đánh giá việc phòng trừ mọt trên cây bông (*Anthonomus grandis*) đơn vị thử nghiệm gồm các đĩa 96 lỗ vi chuẩn độ chứa khẩu phần ăn của côn trùng và 5-10 trứng *A. grandis*.

Hợp chất được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% theo thể tích là

nước và 25% theo thể tích là DMSO. Nồng độ khác nhau của các hợp chất được điều chế được phun lên khẩu phần ăn của côn trùng ở 5 μ l, sử dụng bình xịt nhỏ lắp ráp tùy ý, ở hai mẫu lặp.

Sau khi sử dụng, các đĩa vi chuẩn độ được ủ ở khoảng $25 \pm 1^\circ\text{C}$ và khoảng $75 \pm 5\%$ tùy theo độ ẩm trong 5 ngày. Tỷ lệ chết của ấu trùng và trứng sau đó được đánh giá trực quan.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-3, C-47, C-29, C-40 và C-44 ở 2500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Rệp xanh ở cây đào (*Myzus persicae*)

Để đánh giá việc phòng trừ rệp xanh ở cây đào (*Myzus persicae*) thông qua hệ thống có nghĩa là đơn vị thử nghiệm gồm các đĩa 96 lỗ vi chuẩn độ chứa khẩu phần ăn nhân tạo lỏng dưới màng nhân tạo.

Hợp chất được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% theo thể tích là nước và 25% theo thể tích là DMSO. Nồng độ khác nhau của các hợp chất điều chế được bơm vào khẩu phần ăn của rệp, sử dụng pipet lắp ráp tùy ý, ở hai mẫu lặp.

Sau khi sử dụng, 5 – 8 rệp trưởng thành được đặt lên màng nhân tạo bên trong các lỗ thuộc đĩa vi chuẩn độ. Rệp sau đó được phép hút khẩu phần ăn của rệp đã xử lý và được ủ ở khoảng $23 \pm 1^\circ\text{C}$ và khoảng $50 \pm 5\%$ tùy theo độ ẩm trong 3 ngày. Tỷ lệ chết và sự phong phú của rệp sau đó được đánh giá trực quan.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-2, C-3, C-6, C-8, C-9, C-12, C-13, C-21, C-34, C-45, C-23, C-22, C-24, C-27, C-49, C-47, C-48, C-50, C-29, C-40, C-32, C-43, C-44, C-38, C-17, C-41 và C-31 ở 2500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75% so với đối chứng không được xử lý.

Bọ trĩ phong lan (*Dichromothrips corbetti*)

Dichromothrips corbetti trưởng thành dùng để phân tích sinh học thu được từ quần thể duy trì liên tục dưới điều kiện thí nghiệm. Với mục đích thử nghiệm, hợp chất thử nghiệm được pha loãng trong hỗn hợp 1:1 của axeton:nước (thể tích:thể tích), cộng 0,01% thể tích / thể tích là chất hoạt động bề mặt Alkamuls® EL 620.

Hiệu lực với bọ trĩ của mỗi hợp chất được đánh giá bằng việc sử dụng kỹ thuật

ngâm hoa. Các đĩa nhựa petri được dùng làm đầu trường thử nghiệm. Tất cả các cánh hoa của hoa phong lan còn nguyên vẹn riêng rẽ được nhúng vào dung dịch xử lý và được phép sấy khô. Hoa đã xử lý được đặt vào các đĩa petri riêng rẽ cùng với khoảng 20 bộ trĩ trường thành. Các đĩa petri sau đó được đậy nắp. Tất cả đầu trường thử nghiệm được đặt dưới ánh sáng liên tục và nhiệt độ là khoảng 28°C trong khoảng thời gian thử nghiệm. Sau 3 ngày, số bộ trĩ sống sót được đếm ở mỗi hoa, và dọc bức tường bên trong của mỗi đĩa petri. Phần trăm tỷ lệ chết được ghi lại 72 giờ sau khi xử lý.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-2, C-3, C-6, C-8, C-34, C-45, C-22, C-24, C-27, C-49, C-47, C-28, C-48, C-50, C-29, C-42, C-35 và C-38 at 500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Rầy xanh trên lá lúa (*Nephotettix virescens*)

Các cây lúa non được làm sạch và được rửa 24 giờ trước khi phun. Hợp chất hoạt động được điều chế trong 50:50 axeton:nước (thể tích:thể tích), và 0,1% theo thể tích là chất hoạt động bề mặt (EL 620) được bổ sung. Các cây lúa non đã cấy được phun bằng 5 ml dung dịch thử nghiệm, không khí khô, được đặt trong các lồng và được nuôi bằng 10 con rầy xanh trưởng thành. Cây lúa đã xử lý được giữ ở khoảng 28-29°C và độ ẩm tùy theo là khoảng 50-60%. Phần trăm tỷ lệ chết được ghi lại sau 72 giờ.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-2, C-6, C-8, C-22, C-24, C-47, C-28, C-42 và C-38 at 500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Rầy nâu trên cây lúa (*Nilaparvata lugens*)

Các cây lúa non được làm sạch và được rửa 24 giờ trước khi phun. Hợp chất hoạt động được điều chế trong 50:50 axeton:nước (thể tích:thể tích), và 0,1% theo thể tích là chất hoạt động bề mặt (EL 620) được bổ sung. Các cây lúa non đã cấy được phun bằng 5 ml dung dịch thử nghiệm, không khí khô, được đặt trong các lồng và được nuôi bằng 10 con trưởng thành. Cây lúa đã xử lý được giữ ở khoảng 28-29°C và độ ẩm tùy theo là khoảng 50-60%. Phần trăm tỷ lệ chết được ghi lại sau 72 giờ.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-6, C-24, C-28, C-29, C-42 và C-38 at 500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Nhện đỏ (*Tetranychus spp.*)

Hợp chất hoạt động được hòa tan ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp 1:1 (vol:vol) nước cất: axeton. Dung dịch thử nghiệm được điều chế ở ngày sử dụng.

Cây bông được trồng ở hai tuần tuổi được làm sạch, sấy khô bằng không khí và được nuôi bằng khoảng 50 con ở các giai đoạn khác nhau. Các thực vật được phun sau khi lượng loài gây hại được ghi lại. Phần trăm tỷ lệ chết được ghi lại 72 giờ sau khi xử lý.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-9 và C-42 ở 500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens*)

Để đánh giá đối chứng của sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens*) đơn vị thử nghiệm gồm các đĩa 96 lỗ vi chuẩn độ chứa khẩu phần ăn của côn trùng và 15-25 trứng *H. virescens*.

Hợp chất được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% theo thể tích là nước và 25% theo thể tích là DMSO. Nồng độ khác nhau của hợp chất điều chế được phun lên khẩu phần ăn của côn trùng ở 10 μ l, sử dụng bình xịt nhỏ lắp ráp tùy ý, ở hai mẫu lặp.

Sau khi sử dụng, đĩa vi chuẩn độ được ủ ở khoảng $28 \pm 1^\circ\text{C}$ và khoảng $80 \pm 5\%$ tùy theo độ ẩm trong 5 ngày. Tỷ lệ chết của ấu trùng và trứng sau đó được đánh giá trực quan.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-45, C-44 và C-38 at 2500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75 % so với đối chứng không được xử lý.

Rệp ở cây đậu tằm (*Megoura viciae*)

Để đánh giá việc phòng trừ rệp ở cây đậu tằm (*Megoura viciae*) thông qua tiếp xúc hoặc hệ thống có nghĩa là đơn vị thử nghiệm gồm đĩa vi chuẩn độ 24 lỗ chứa đĩa lá đậu rộng.

Hợp chất được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% theo thể tích là nước và 25% theo thể tích là DMSO. Nồng độ khác nhau của hợp chất điều chế được

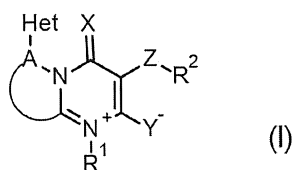
phun lên đĩa lá ở 2,5 μ l, sử dụng bình xịt nhỏ lắp ráp tùy ý, ở hai mẫu lặp.

Sau khi sử dụng, đĩa lá được sấy khô bằng không khí và 5 – 8 rệp trưởng thành được đặt lên đĩa lá bên trong các giếng ở tâm vi hiệu giá. Rệp sau đó được phép tới müt đĩa lá đã xử lý và được ủ ở khoảng $23 \pm 1^\circ\text{C}$ và khoảng $50 \pm 5\%$ độ ẩm tùy theo trong 5 ngày. Tỷ lệ chết và sự phong phú của rệp sau đó được đánh giá trực quan.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất C-1, C-2, C-3, C-6, C-8, C-9, C-13, C-34, C-45, C-22, C-24, C-27, C-49, C-47, C-48, C-50, C-29, C-40, C-44, C-38, C-19 và C-31 at 2500 ppm đã thể hiện tỷ lệ chết trên 75% so với đối chứng không được xử lý.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất pyrimidini được thể có công thức (I)



trong đó

mỗi X, Y độc lập là O hoặc S;

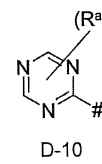
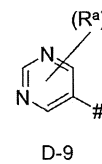
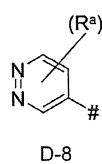
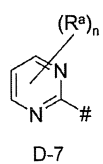
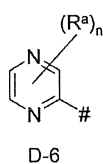
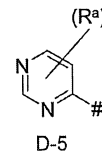
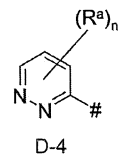
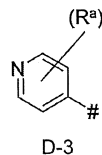
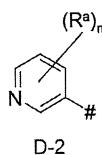
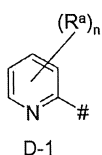
Z được chọn từ nhóm gồm liên kết trực tiếp, O, S(O), NR^b, C(R^aR^{aa})O, C(=X¹), C(=X¹)Y¹, và Y¹C(=X¹);

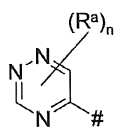
X¹ được chọn từ nhóm gồm O, S, và NR^b;

Y¹ được chọn từ nhóm gồm O, S, và NR^c;

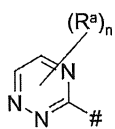
A là CH hoặc N và, trong đó nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng có bốn đến bảy cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa 3 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 O, tối đa 2 S, và tối đa 3 N(R^c)_p, trong đó tối đa 2 thành phần vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S), và thành phần vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S(=O)_m, trong đó mỗi vòng có thể được thể bằng tối đa 3 R^a;

Het được chọn từ hệ vòng bất kỳ trong số các hệ vòng từ D-1 đến D-56 sau đây:

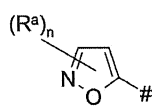




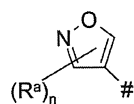
D-11



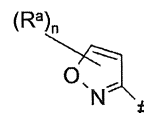
D-12



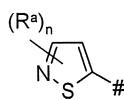
D-13



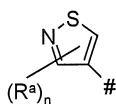
D-14



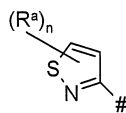
D-15



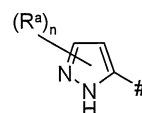
D-16



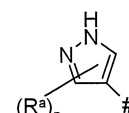
D-17



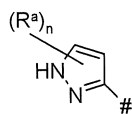
D-18



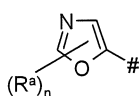
D-19



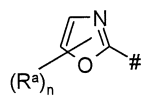
D-20



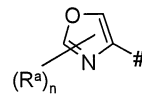
D-21



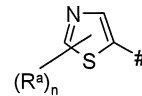
D-22



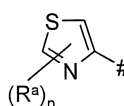
D-23



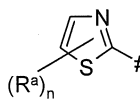
D-24



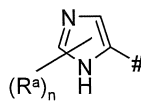
D-25



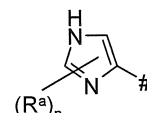
D-26



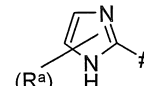
D-27



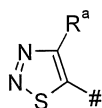
D-28



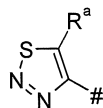
D-29



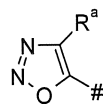
D-30



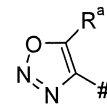
D-31



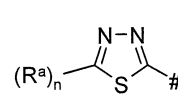
D-32



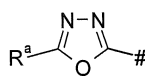
D-33



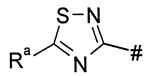
D-34



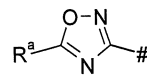
D-35



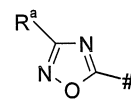
D-36



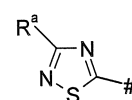
D-37



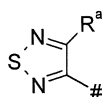
D-38



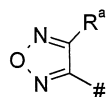
D-39



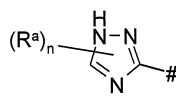
D-40



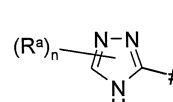
D-41



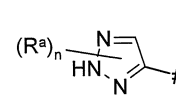
D-42



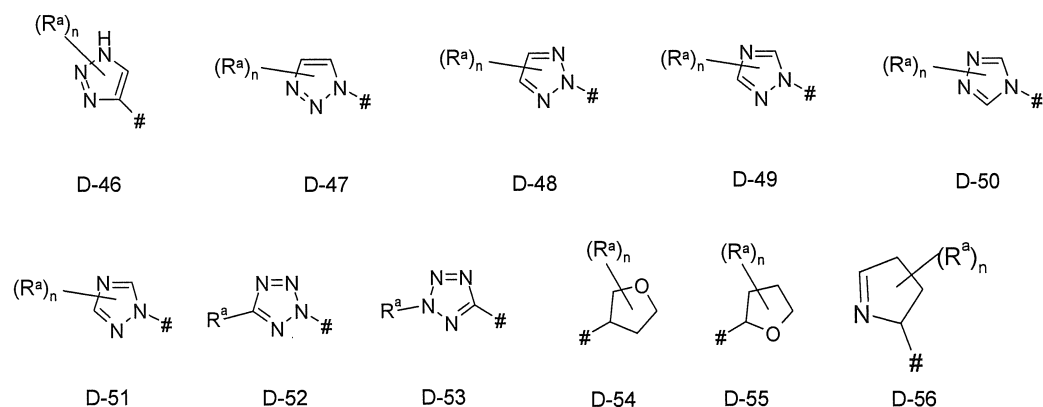
D-43



D-44



D-45



trong đó # dùng để chỉ liên kết với A trong công thức (I);

R^1 được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_3 - C_{10} -xycloalkyl, C_4 - C_{10} -xycloalkenyl, C_5 - C_{14} -xycloalkylxycloalkyl hoặc R^1 có thể tạo thành vòng hoặc hệ vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến mười một cạnh, có thể chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, và trong đó các nhóm nêu trên và hệ vòng cacbon hoặc dị vòng có thể không được thế, được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^a ; hoặc

R^1 được chọn từ nhóm gồm $C(=O)R^b$, $C(=O)OR^e$, NR^bR^c , $(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $SO_2NR^bR^c$, $OC(=O)R^c$, $OC(=O)OR^e$, $OC(=O)NR^bR^c$, $N(R^c)C(=O)R^c$, $N(R^c)C(=O)OR^e$, $N(R^c)C(=O)NR^bR^c$, $NR^cSO_2R^b$, $NR^cSO_2NR^bR^c$, $Si(R^d)_3$, $C(=NR^c)R^c$, $C(=NOR^c)R^c$, $C(=NNR^bR^c)R^c$, $C(=NN(C(=O)R^b)R^c)R^c$, $C(=NN(C(=O)OR^e)(R^c)_2)$, $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$ và $N=CR^bR^c$;

mỗi R^a độc lập được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , $C(=O)(O)_pR^c$, $OC(=O)(O)_pR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $NR^bC(=O)(O)_pR^c$, $NR^bC(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $S(O)_mR^b$, $SO_2NR^bR^c$, OSO_2R^c , $OSO_2NR^bR^c$, $NR^bSO_2R^c$, $NR^bSO_2NR^bR^c$, $N=S(=O)_pR^cR^c$, $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, SF_5 , OCN, SCN, $Si(R^d)_3$ và vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^c)_p$, O, và S mà có thể được oxy hóa, và trong đó

các nhóm nêu trên và vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} , hoặc

hai nhóm R^a được gắn từng cặp với nhau có thể tạo thành nhóm được chọn từ nhóm gồm $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

mỗi R^{aa} độc lập được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy và C_1 - C_6 -haloalkoxy;

mỗi R^b độc lập được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy hoặc vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa và vòng cacbon hoặc dị vòng này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

mỗi R^c độc lập được chọn từ nhóm gồm hydro, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 xycloalkyl, và vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^{aa})_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

trong đó hai nhóm R^bR^b , R^cR^b hoặc R^cR^c được gắn từng cặp với nhau cùng với nguyên tử mà chúng được gắn vào, có thể tạo thành vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có 3, 4, 5, 6 hoặc 7 cạnh, có thể chứa 1 đến 2 nguyên tử hoặc nhóm nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm N, O, S, NO, SO và SO_2 và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^3 ;

mỗi R^d độc lập được chọn từ nhóm gồm hydro, phenyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -xycloalkyl, và C_1 - C_6 -alkoxyalkyl, trong đó các nhóm được đề cập ở trên có thể được thế bằng một hoặc nhiều halogen;

mỗi R^e độc lập được chọn từ nhóm gồm C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 xycloalkyl, và vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3

nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^{aa})_p$, O và S, trong đó S có thể được oxy hóa và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{aa} ;

n bằng 0, 1 hoặc 2;

m bằng 0, 1, hoặc 2;

p bằng 0 hoặc 1;

R^2 được chọn từ nhóm gồm H, halogen, CN, C_1 - C_8 alkyl, C_2 - C_8 alkenyl, C_2 - C_8 alkynyl, C_3 - C_{10} xycloalkyl, C_4 - C_{10} alkylxycloalkyl, C_4 - C_{10} xycloalkylalkyl, C_6 - C_{14} xycloalkylxycloalkyl, C_5 - C_{10} alkylxycloalkylalkyl, và C_3 - C_6 xycloalkenyl, trong đó các nhóm nêu trên có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , hoặc R^2 có thể tạo thành vòng cacbon hoặc dị vòng có ba đến mười cạnh hoặc hệ vòng có bảy đến mười một cạnh, vòng hoặc hệ vòng này có thể no, không no một phần, hoặc thơm, và vòng hoặc hệ vòng có thể chứa 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa, và trong đó vòng cacbon hoặc dị vòng hoặc hệ vòng có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} ;

với điều kiện là nếu R^2 là halogen hoặc CN, thì Z là liên kết trực tiếp;

mỗi R^{2a} độc lập được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , $C(=O)(O)_pR^c$, $OC(=O)(O)_pR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $NR^bC(=O)(O)_pR^c$, $NR^bC(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $S(O)_mR^b$, $SO_2NR^bR^c$, OSO_2R^c , $OSO_2NR^bR^c$, $NR^bSO_2R^c$, $NR^bSO_2NR^bR^c$, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^d)_3$, $C(=N(O)_pR^b)R^b$, $C(=NNR^bR^c)R^b$, $C(=NN(C(=O)O_pR^c)R^c)R^b$, $ON=CR^bR^c$, ONR^bR^c , $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, $SO_2NR^b(=O)NR^bR^c$, $P(=X^2)R^bR^c$, $OP(=X^2)(O_pR^c)R^b$, $OP(=X^2)(OR^c)_2$, $N=CR^bR^c$, $NR^bN=CR^bR^c$, $NR^bNR^bR^c$, $NR^bC(=S)NR^bR^c$, $NR^bC(=NR^b)NR^bR^c$, $NR^bNR^bC(=X^2)NR^bR^c$, $NR^bNR^bSO_2NR^bR^c$, $N=S(=O)_pR^cR^c$, và vòng cacbon hoặc dị vòng no, hoặc không no một phần hoặc thơm có ba đến sáu cạnh, có thể chứa 1 đến 3 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm $N(R^c)_p$, O, và S, trong đó S có thể được oxy hóa,

và trong đó các nhóm nêu trên và vòng carbon hoặc dị vòng có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2aa} hoặc

hai nhóm R^{2a} được gắn từng cặp với nhau có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ nhóm gồm $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

mỗi R^{2aa} độc lập được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , $C(=O)(O)_pR^c$, $OC(=O)(O)_pR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $NR^bC(=O)(O)_pR^c$, $NR^bC(=O)NR^bR^c$, $C(=S)NR^bR^c$, $S(O)_mR^b$, $SO_2NR^bR^c$, OSO_2R^c , $OSO_2NR^bR^c$, $NR^bSO_2R^c$, $NR^bSO_2NR^bR^c$, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^d)_3$, $C(=N(O)_pR^b)R^b$, $C(=NNR^bR^c)R^b$, $C(=NN(C(=O)O_pR^c)R^b)R^b$, $ON=CR^bR^c$, ONR^bR^c , $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, $SO_2NR^b(=O)NR^bR^c$, $P(=X^2)R^bR^c$, $OP(=X^2)(O_pR^c)R^b$, $OP(=X^2)(OR^c)_2$, $N=CR^bR^c$, $NR^bN=CR^bR^c$, $NR^bNR^bR^c$, $NR^bC(=S)NR^bR^c$, $NR^bC(=NR^b)NR^bR^c$, $NR^bNR^bC(=X^2)NR^bR^c$, $NR^bNR^bSO_2NR^bR^c$, và $N=S(=O)_pR^cR^c$ hoặc

hai nhóm R^{2aa} được gắn từng cặp với nhau có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ nhóm gồm $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

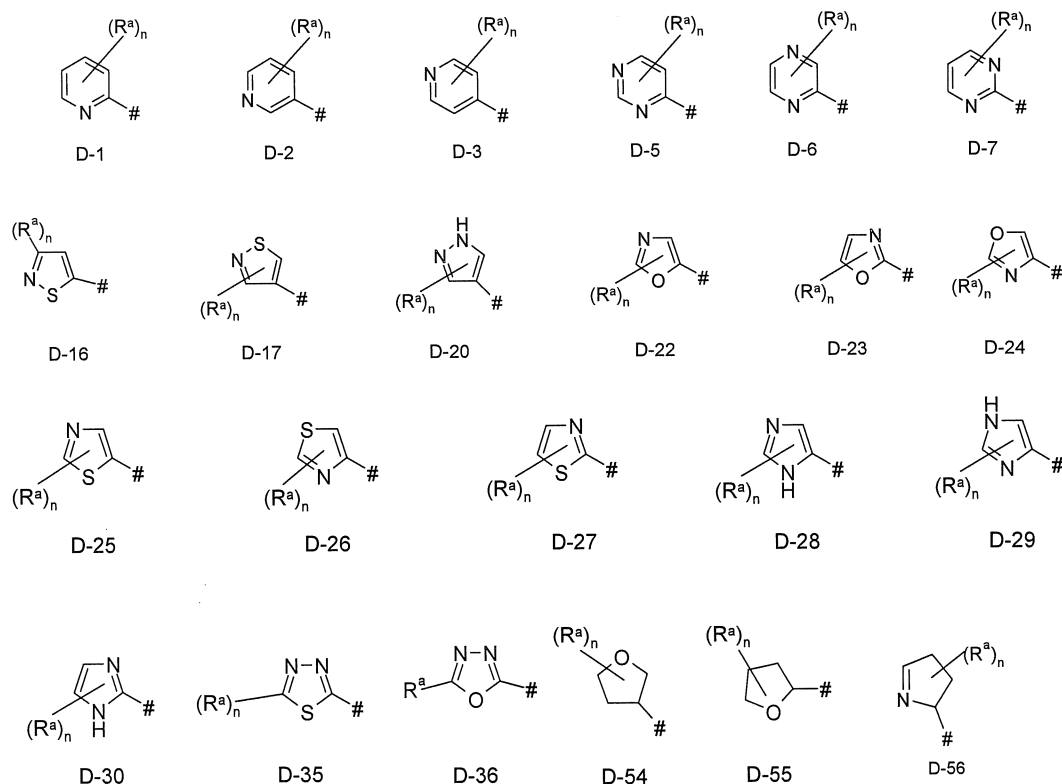
X^2 độc lập là O hoặc S;

mỗi R^3 độc lập được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, CN, OR^c , NR^bR^c , NO_2 , $C(=O)(O)_pR^c$, $OC(=O)(O)_pR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, $OC(=O)NR^bR^c$, $NR^bC(=O)(O)_pR^c$, $NR^bC(=O)NR^bR^c$, $(=S)NR^bR^c$, $S(O)_mR^b$, $SO_2NR^bR^c$, OSO_2R^c , $OSO_2NR^bR^c$, $NR^bSO_2R^c$, $NR^bSO_2NR^bR^c$, SF_5 , OCN , SCN , $Si(R^d)_3$, $C(=N(O)_pR^b)R^b$, $C(=NNR^bR^c)R^b$, $C(=NN(C(=O)O_pR^c)R^b)R^b$, $ON=CR^bR^c$, ONR^bR^c , $S(=O)_o(=NR^b)_qR^c$, $SO_2NR^b(=O)NR^bR^c$, $P(=X^2)R^bR^c$, $OP(=X^2)(O_pR^c)R^b$, $OP(=X^2)(OR^c)_2$, $N=CR^bR^c$, $NR^bN=CR^bR^c$, $NR^bNR^bR^c$, $NR^bC(=S)NR^bR^c$, $NR^bC(=NR^b)NR^bR^c$, $NR^bNR^bC(=X^2)NR^bR^c$, $NR^bNR^bSO_2NR^bR^c$, và $N=S(=O)_pR^cR^c$ hoặc

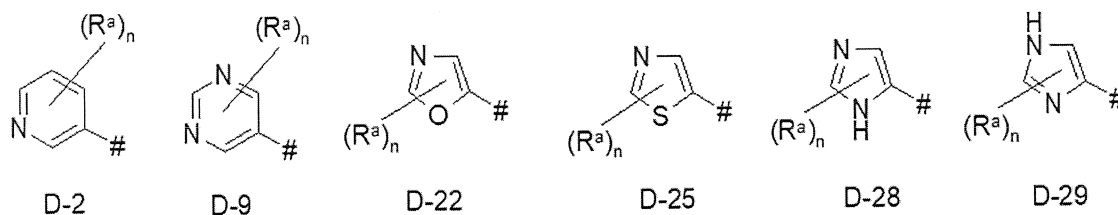
hai nhóm R^3 được gắn từng cặp với nhau có thể cùng nhau tạo thành nhóm được chọn từ nhóm gồm $=O$, $=S$, $=CR^bR^c$, $=NR^c$, $=NOR^c$, và $=NNR^cR^c$;

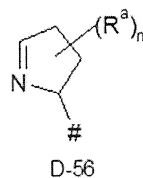
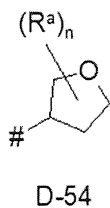
và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng.

2. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng theo điểm 1, trong đó Het được chọn từ hệ vòng bất kỳ trong số các hệ vòng sau:



3. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng theo điểm 1 hoặc 2, trong đó Het được chọn từ các cấu trúc D-2, D-9, D-22, D-25, D-28, D-29 và D-54:





trong đó:

R^a được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy hoặc C_1 - C_4 -alkylthio và phenyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2, và bất kể được sử dụng ở đâu trong cấu trúc, ký hiệu sau:

dùng để chỉ liên kết với A trong công thức (I).

4. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 3, trong đó:

mỗi X, Y là O;

A là CH và nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ 2 và 3 nguyên tử cacbon;

R^1 được chọn từ nhóm gồm CH_3 , CH_2CH_3 , isopropyl, xyclopropyl, CH_2CF_3 , phenyl, allyl và benzyl;

R^2 là phenyl có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy hoặc phenyl;

Z là liên kết trực tiếp và

Het được chọn từ nhóm gồm D-2, D-9, D-25 hoặc D-56 và R^a là Cl, Br, F, SCH_3 , CF_3 , OCH_3 hoặc phenyl.

5. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1, trong đó A là CH hoặc N, trong đó nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liền kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ các

nguyên tử cacbon và tối đa một nguyên tử khác loại được chọn từ O, S và $N(R^c)_p$, vòng này có thể được thế bằng R^a .

6. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1, trong đó X và Y là O.

7. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1, trong đó:

Z là liên kết trực tiếp, và

R^2 là vòng cacbon hoặc dị vòng có sáu cạnh, vòng này có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , và trong đó R^{2a} được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, phenyl, và pyridyl, có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy.

8. Hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1, trong đó:

R^1 được chọn từ nhóm gồm C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, benzyl và phenyl, các nhóm có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen hoặc C_1 - C_4 -alkyl.

9. Chế phẩm dùng trong nông nghiệp chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I), như được xác định trong điểm 1, và ít nhất một chất mang lỏng và/hoặc rắn trơ.

10. Chế phẩm dùng trong nông nghiệp để chống lại động vật gây hại chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng, như được xác định trong điểm 1, và ít nhất một chất mang trơ có thể chấp nhận dạng lỏng và/hoặc dạng rắn và, nếu cần, ít nhất một chất hoạt động bề mặt.

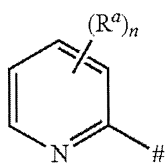
11. Hạt giống được xử lý bằng hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-

oxit của chúng như được xác định trong điểm 1 với lượng nằm trong khoảng từ 0,1 g đến 10 kg trên 100 kg hạt giống.

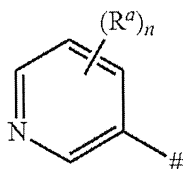
12. Phương pháp bảo vệ cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và/hoặc thực vật đang sinh trưởng khỏi sự tấn công hoặc sự xâm nhiễm bởi loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và thực vật đang sinh trưởng, hoặc đất trồng, vật liệu, bề mặt, khoảng không, diện tích hoặc nước trong đó cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật này được lưu giữ hoặc thực vật đang sinh trưởng xử lý hoặc tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1.

13. Phương pháp theo điểm 12, trong đó Het được chọn từ hệ vòng bất kỳ trong số các hệ vòng sau đây:

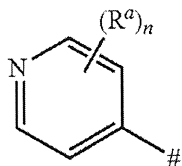
D-1



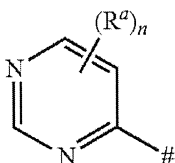
D-2



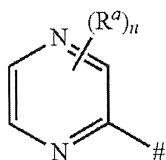
D-3



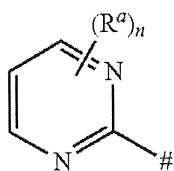
D-5



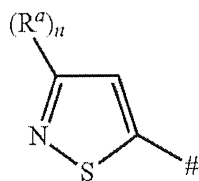
D-6



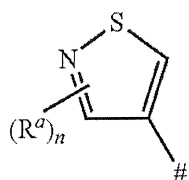
D-7



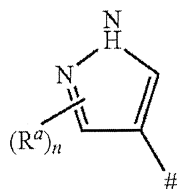
D-16



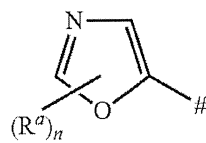
D-17



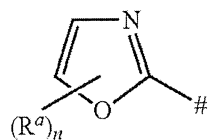
D-20



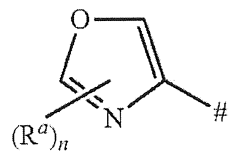
D-22



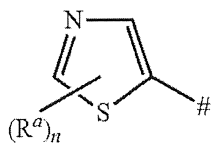
D-23



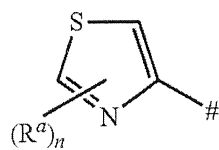
D-24



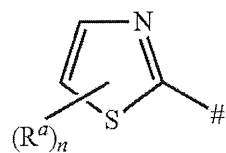
D-25



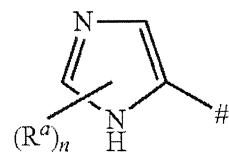
D-26



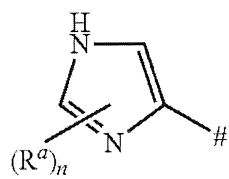
D-27



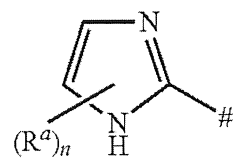
D-28



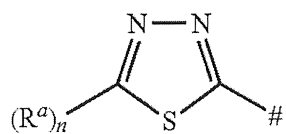
D-29



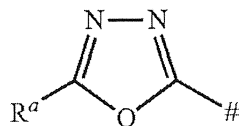
D-30



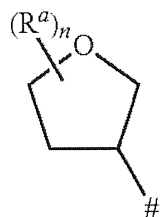
D-35



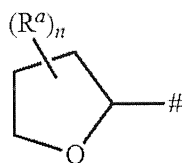
D-36



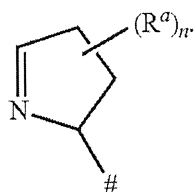
D-54



D-55

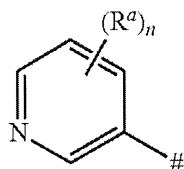


D-56

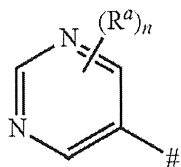


14. Phương pháp theo điểm 12, trong đó Het được chọn từ các cấu trúc D-2, D-9, D-22, D-25, D-28, D-29 và D-54:

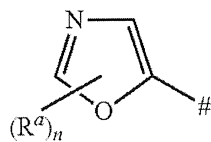
D-2



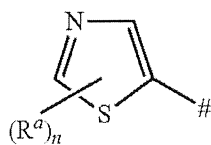
D-9



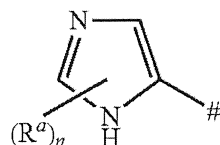
D-22



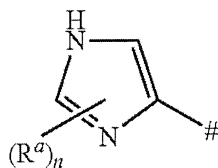
D-25



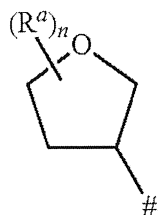
D-28



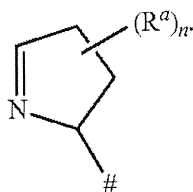
D-29



D-54



D-56



trong đó:

R^a được chọn từ nhóm gồm halogen, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio và

phenyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2, và bất kể được sử dụng ở đâu trong cấu trúc, ký hiệu sau:

dùng để chỉ liên kết với A trong công thức (I).

15. Phương pháp theo điểm 14, trong đó:

mỗi X, Y là O;

A là CH và nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liên kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ 2 và 3 nguyên tử cacbon;

R^1 được chọn từ nhóm gồm CH_3 , CH_2CH_3 , isopropyl, xyclopropyl, CH_2CF_3 , phenyl, allyl và benzyl;

R^2 là phenyl có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy hoặc phenyl;

Z là liên kết trực tiếp và

Het được chọn từ nhóm gồm D-2, D-9, D-25 hoặc D-56 và R^a là Cl, Br, F, SCH_3 , CF_3 , OCH_3 hoặc phenyl.

16. Phương pháp theo điểm 12, trong đó A là CH hoặc N, trong đó nitơ của vòng pyrimidini cùng với nguyên tử cacbon liên kết liên kề và A như được thể hiện trong công thức (I) tạo thành vòng năm hoặc sáu cạnh, trong đó mỗi thành phần vòng còn lại được chọn từ nguyên tử cacbon và lên tới một nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm O, S, và $N(R^c)_p$, vòng này có thể được thế bằng R^a .

17. Phương pháp theo điểm 12, trong đó X và Y là O.

18. Phương pháp theo điểm 12, trong đó:

Z là liên kết trực tiếp, và

R^2 là vòng cacbon hoặc dị vòng có sáu cạnh, vòng này có thể không được thế, được thế một phần, hoặc được thế hoàn toàn bằng R^{2a} , và trong đó R^{2a} được chọn từ nhóm gồm halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, $C(=O)OR^c$, $C(=O)NR^bR^c$, phenyl, và pyridyl, có thể được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -haloalkyl hoặc C_1 - C_6 -haloalkoxy.

19. Phương pháp theo điểm 12, trong đó:

R^1 được chọn từ nhóm gồm C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, benzyl và phenyl, các nhóm này có thể được thế một phần hoặc được thế hoàn toàn bằng halogen hoặc C_1 - C_4 -alkyl.

20. Phương pháp chống lại, phòng trừ, ngăn ngừa hoặc bảo vệ chống lại sự xâm nhiễm hoặc bị lây nhiễm bởi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm bước cho các loài gây hại này hoặc nguồn cung cấp thức ăn, môi trường sống hoặc nơi sinh sản của nó tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1.

21. Phương pháp không nhằm mục đích trị liệu để xử lý động vật bị xâm nhiễm hoặc bị lây nhiễm bởi vật ký sinh hoặc bảo vệ động vật khỏi bị xâm nhiễm hoặc bị lây nhiễm bởi vật ký sinh, bao gồm bước sử dụng hoặc áp dụng tại chỗ cho động vật này lượng hữu hiệu có tác dụng diệt vật ký sinh của hợp chất có công thức (I) và/hoặc chất đồng phân lập thể hoặc muối có thể chấp nhận trong nông nghiệp hoặc trong thú y hoặc tautome hoặc N-oxit của chúng như được xác định trong điểm 1.

22. Phương pháp bảo vệ cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và/hoặc thực vật đang sinh trưởng khỏi sự tấn công hoặc sự xâm nhiễm bởi loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và thực vật đang sinh trưởng, hoặc đất trồng, vật liệu, bề mặt, khoảng không, diện tích hoặc nước trong đó cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật này được lưu giữ hoặc thực vật đang sinh trưởng xử lý hoặc tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt loài gây hại của chế phẩm theo điểm 9.

23. Phương pháp chống lại, phòng trừ, hoặc bảo vệ chống lại sự xâm nhiễm hoặc lây nhiễm bởi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm bước cho các loài gây hại này hoặc nguồn cung cấp thức ăn, môi trường sống hoặc nơi sinh sản của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt loài gây hại của chế phẩm theo điểm 9.