



(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)



1-0036056

(51)⁷ C07D 487/04; A01N 43/90

(13) B

(21) 1-2019-06855

(22) 07/05/2018

(86) PCT/EP2018/061652 07/05/2018

(87) WO2018/206479 15/11/2018

(30) 17170404.2 10/05/2017 EP

(45) 26/06/2023 423

(43) 25/02/2020 383A

(73) BASF SE (DE)

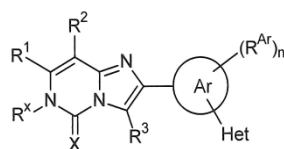
Carl-Bosch-Strasse 38, 67056 Ludwigshafen am Rhein, Germany

(72) MCLAUGHLIN, Martin John (US); Narine, Arun (CA); VON DEYN, Wolfgang (DE); GOCKEL, Birgit (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT HAI VÒNG DIỆT SINH VẬT GÂY HẠI, CHẾ PHẨM VÀ HẠT CHỨA CHÚNG, PHƯƠNG PHÁP PHI ĐIỀU TRỊ ĐỂ CHỐNG LẠI HOẶC PHÒNG TRỪ SINH VẬT GÂY HẠI KHÔNG XƯƠNG SỐNG VÀ BẢO VỆ THỰC VẬT ĐANG SINH TRƯỞNG KHỎI SỰ TẤN CÔNG HOẶC PHÁ HOẠI BỞI CÁC SINH VẬT NÀY

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



(I)

trong đó các tham biến được định nghĩa như được nêu trong phần mô tả và yêu cầu bảo hộ. Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm, hạt chứa các hợp chất (I), phương pháp phi điều trị để chống lại hoặc phòng trừ sinh vật gây hại không xương sống, phương pháp phi điều trị để xử lý và bảo vệ động vật khỏi sự phá hoại hoặc nhiễm bởi các sinh vật gây hại không xương sống và phương pháp bảo vệ thực vật đang sinh trưởng tránh khỏi sự tấn công hoặc phá hoại bởi các sinh vật gây hại không xương sống bằng cách sử dụng các hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các hợp chất hai vòng được thể có công thức I làm chất diệt sinh vật gây hại hóa nông. Hơn nữa, sáng chế còn đề cập đến các quy trình và các chất trung gian để điều chế các hợp chất có công thức I và đề cập đến các chế phẩm kết hợp hợp chất hoạt tính chứa chúng. Hơn nữa, sáng chế còn đề cập đến chế phẩm nông nghiệp hoặc thú y chứa các hợp chất có công thức I, và đến việc sử dụng các hợp chất có công thức I hoặc các chế phẩm chứa chúng để chống lại hoặc phòng trừ sinh vật gây hại không xương sống và/hoặc để bảo vệ cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, và/hoặc để phát triển thực vật chống lại sự tấn công và/hoặc phá hoại của các sinh vật gây hại không xương sống. Sáng chế cũng đề cập đến các phương pháp áp dụng các hợp chất có công thức I. Hơn nữa, sáng chế còn đề cập đến hạt chứa các hợp chất theo sáng chế.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Sinh vật gây hại không xương sống và cụ thể là côn trùng, động vật lớp nhện và giun tròn triệt phá cây trồng đang sinh trưởng và đã thu hoạch và tấn công các công trình kiến trúc nhà ở và thương mại làm từ gỗ, gây thiệt hại lớn về mặt kinh tế cho các nhà cung cấp lương thực và cho bất động sản. Do đó, đang có nhu cầu về các chất mới để chống lại các sinh vật gây hại không xương sống.

Các dị vòng ngưng tụ ở vị trí 5,6 đã được biết để sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ, trong các công bố đơn quốc tế WO 2012/086848, WO 2013/180193 và WO 2014/119670 và là nhóm chất diệt côn trùng quan trọng. Ngoài ra, cũng viện dẫn tới các công bố đơn quốc tế WO 2017/043386, WO 2017/043386, WO 2017/025419, WO 2017/001314, và WO 2016/023954.

Do các các sinh vật gây hại mục tiêu có khả năng phát triển tính kháng lại các chất có

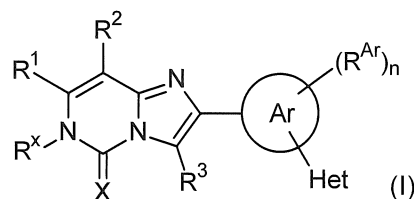
hoạt tính diệt sinh vật gây hại, nên đang có nhu cầu nhận diện các hợp chất khác, là thích hợp để chống lại các sinh vật gây hại không xương sống như côn trùng, động vật lớp nhện và giun tròn. Hơn nữa, cũng cần có các hợp chất mới có hoạt tính diệt sinh vật gây hại cao và thể hiện phổ hoạt tính rộng chống lại một số lượng lớn các sinh vật gây hại không xương sống khác nhau, đặc biệt là chống lại sự khó khăn trong việc phòng trừ côn trùng, động vật lớp nhện và giun tròn.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, mục đích của sáng chế là nhận diện và đề xuất các hợp chất, mà có hoạt tính diệt sinh vật gây hại cao và có phổ hoạt tính rộng chống lại sinh vật có hại không xương sống.

Đã phát hiện ra rằng các mục đích này có thể đạt được bằng các hợp chất hai vòng được thể có công thức I, như được mô tả và định nghĩa dưới đây, bao gồm các chất đồng phân lập thể của chúng, các muối của chúng, cụ thể là các muối có thể chấp nhận được trong nông nghiệp hoặc trong thú y của chúng, các chất hỗ biến và các N-oxit của chúng.

Theo khía cạnh thứ nhất, sáng chế đề cập đến hợp chất hai vòng có công thức I,



trong đó

X là O hoặc S;

R^x được chọn từ nhóm bao gồm C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alkylen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alkylen-NR^bR^c, C₁-C₆-alkylen-CN, NH-C₁-C₆-alkylen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c, S(=O)_mR^e, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f;

R^1 là H, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy, C₁-C₆-alkylsulfenyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, hoặc C₁-C₆-alkylsulfonyl mà được thế hoặc không được thế bằng halogen;

R^2 , R^3 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm H, halogen, N_3 , CN, NO_2 , -SCN, $-SF_5$, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyl, tri- C_1-C_6 -alkylsilyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkoxy, C_3-C_6 -xycloalkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy, C_3-C_6 -xycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy- C_1-C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, $C(O)-OR^a$, NR^bR^c , C_1-C_6 -alkylen- NR^bR^c , $O-C_1-C_6$ -alkylen- NR^bR^c , C_1-C_6 -alkylen-CN, $NH-C_1-C_6$ -alkylen- NR^bR^c , $C(O)-NR^bR^c$, $C(O)-R^d$, $SO_2NR^bR^c$ và $S(=O)_mR^e$, một gốc cũng có thể là phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio hoặc benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

Ar là phenyl hoặc heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh,

R^{Ar} độc lập với nhau, được chọn từ nhóm bao gồm halogen, N_3 , OH, CN, NO_2 , -SCN, $-SF_5$, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyl, tri- C_1-C_6 -alkylsilyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkoxy, C_3-C_6 -xycloalkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy, C_3-C_6 -xycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy- C_1-C_4 -alkyl, các nhóm này không được thế hoặc được thế bằng halogen, $C(O)-OR^a$, NR^bR^c , C_1-C_6 -alkylen- NR^bR^c , $O-C_1-C_6$ -alkylen- NR^bR^c , C_1-C_6 -alkylen-CN, $NH-C_1-C_6$ -alkylen- NR^bR^c , $C(O)-NR^bR^c$, $C(O)-R^d$, $SO_2NR^bR^c$ và $S(=O)_mR^e$, một gốc cũng có thể là phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio hoặc benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

Het là heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh hoặc heteroxyclyl có 5 hoặc 6 cạnh, mà không được thế hoặc được thế bằng R;

R là halogen, oxo ($=O$), N_3 , OH, CN, NO_2 , SCN, SF_5 , C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_6 -haloalkyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_6 -alkoxycarbonyl, C_3-C_6 -xycloalkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy, C_3-C_6 -xycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy- C_1-C_4 alkyl, phenyl, heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh, hoặc heteroxyclyl có 5 hoặc 6 cạnh, trong đó các nhóm vòng của R không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

với điều kiện rằng R^{Ar} và Het đều không có mặt trên cùng một nguyên tử của Ar;

mỗi R^a được chọn từ H, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -xycloalkyl, C_3-C_6 -xycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -xycloalkoxy- C_1-C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, C_1-C_6 -alkylen- NR^bR^c , C_1-C_6 -alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

mỗi R^b được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, $-(C=O)R$, $-(C=O)OR$, và $-(C=O)NR$, C₁-C₆-alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó phenyl này không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f ;

mỗi R^c được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, C₁-C₆-alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

mỗi gốc NR^bR^c cũng có thể tạo thành dị vòng có 3 đến 8 cạnh bão hòa, liên kết N, dị vòng này, ngoài nguyên tử nitơ, có thể có 1 hoặc 2 nguyên tử khác loại khác hoặc các gốc nguyên tử khác loại khác được chọn từ O, $S(=O)_m$ và $N-R'$, trong đó R' là H hoặc C₁-C₆-alkyl và trong đó dị vòng liên kết N này không được thế hoặc được thế bằng các gốc được chọn từ halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy và C₁-C₄-haloalkoxy;

mỗi R^d được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen,

phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

mỗi R^e được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen,

phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng R^f ;

mỗi R^f được chọn từ halogen, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1 hoặc 2;

n bằng 0, 1 hoặc 2;

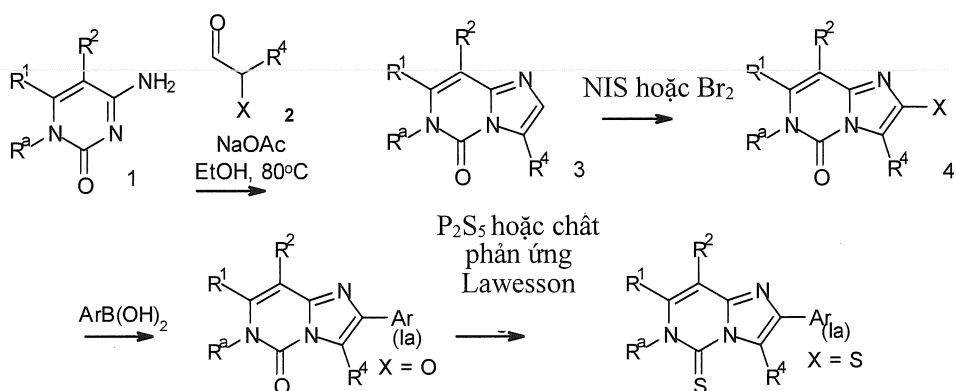
và các N-oxit, chất đồng phân lập thể, chất hỗn biến và muối của chúng có thể chấp nhận được trong nông nghiệp hoặc trong thú y.

Mô tả chi tiết sáng chế

Với sự cải biến thích hợp của các hợp chất ban đầu, hợp chất có công thức I có thể được điều chế bằng các quy trình như được thể hiện trong các sơ đồ dưới đây.

6H-imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-thion Ia (X = S) có thể được điều chế trong quy trình tổng hợp 4 bước bắt đầu từ các xytidin 1 (Sơ đồ 1). Việc ngưng tụ các xytidin 1 với alpha-haloaldehyt 2 bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Jansa et al. *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 52(5), 1382-1389; 2015 thu được các vòng đôi 3, mà có thể được halogen hóa bằng, ví dụ NIS hoặc NBS, bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Jansa et al. *Tetrahedron*, 71(1), 27-36; 2015. Các halua 4 lần lượt có thể được đưa vào phản ứng liên hợp Suzuki với axit arylboronic để tạo ra 6H-imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on Ia (X = O) bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Lee et al. *PCT Int. Appl.*, 2009093981, 30 Jul 2009. Cuối cùng, phản ứng của các hợp chất Ia (X = O) với các chất thiolat hóa như P₂S₅ hoặc chất phản ứng Lawesson sẵn sàng thu được các hợp chất Ia (X = S) bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Bigot et al. *PCT Int. Appl.*, 2015052103, 16 Apr 2015. Quy trình điều chế xytidin được thể triflometyl 1 (R¹ = CF₃, R² = H, R^a = H) đã được mô tả trước đây (Gershon et al. *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 20(1), 219-23; 1983).

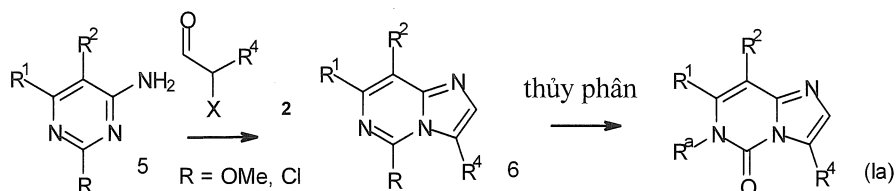
Sơ đồ 1



Theo cách khác, các hợp chất 6 có thể được điều chế bằng cách ngưng tụ các aminopyridin 5 với aldehyt 2 bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Wade et al. U.S., 4503050, 05 Mar 1985 (Sơ đồ 2). Thủy phân clo hoặc nhóm metoxy trong

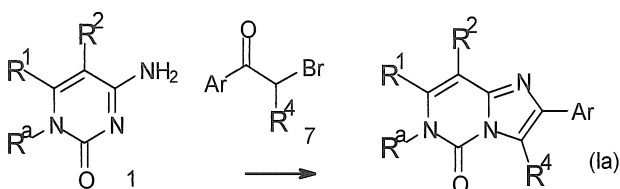
các hợp chất 6 ($R = Cl, OMe$) trong các điều kiện đã biết trong tài liệu có thể thu được các hợp chất (Ia).

Sơ đồ 2



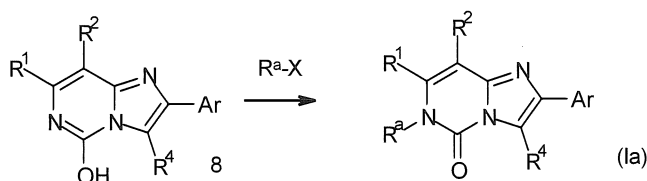
Ngưng tụ trực tiếp alpha-halo-alpha-keton (ví dụ 7) và các xytidin 1 có thể trực tiếp thu được các hợp chất (Ia) bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Meng et al. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 23(10), 2863-2867; 2013 (Sơ đồ 3).

Sơ đồ 3



Các hợp chất Ia có thể được điều chế bằng cách alkyl hóa N các hợp chất 8 với chất alkyl hóa R^a-X bằng phương pháp tương tự như phương pháp được mô tả trong Martin-Martin et al. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 25(6), 1310-1317; 2015 (Sơ đồ 4).

Sơ đồ 4



Các quy trình mô tả nêu trên có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc ở dạng kết hợp với chất khác để thu được các hợp chất có công thức I.

Các vật liệu ban đầu cần thiết để điều chế các hợp chất có công thức I là có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo các quy trình đã biết trong tài liệu tham khảo.

Hỗn hợp phản ứng được xử lý theo cách thông thường, ví dụ, bằng cách trộn với nước, tách riêng các pha và nếu thích hợp, tinh chế bằng phương pháp sắc ký các sản phẩm thô. Một số hợp chất trung gian và sản phẩm cuối thu được ở dạng dầu nhớt không màu hoặc màu nâu nhạt mà được tinh chế hoặc được tách các thành phần bay hơi trong điều kiện áp suất giảm

thấp và ở nhiệt độ tăng cao vừa phải. Nếu các hợp chất trung gian và các sản phẩm cuối thu được ở dạng rắn, bước tinh chế cũng có thể được thực hiện bằng cách tái kết tinh hoặc phân cắt.

Nếu các hợp chất riêng rẽ có công thức I không thể thu được bằng các đường nêu trên, thì chúng có thể được điều chế bằng cách tạo dẫn xuất các hợp chất khác có công thức I hoặc các hợp chất trung gian của nó.

Nếu quy trình tổng hợp thu được các hỗn hợp của các chất đồng phân thì bước tách thường không nhất thiết là bắt buộc vì trong một số trường hợp các chất đồng phân riêng rẽ có thể được hoán chuyển trong quá trình xử lý để sử dụng hoặc trong quá trình ứng dụng (ví dụ, dưới tác dụng của ánh sáng, axit hoặc bazơ). Các chuyển hóa này có thể còn diễn ra sau khi sử dụng, ví dụ, trong việc xử lý thực vật trong thực vật đã được xử lý, hoặc trong các loài nấm có hại được phòng trừ.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ dễ dàng hiểu rằng các ưu tiên đối với các nhóm thế, cụ thể là đối với các ưu tiên được nêu trong các bảng dưới đây cho các nhóm thế tương ứng, được nêu ở đây liên quan đến các hợp chất I, cũng áp dụng cho các hợp chất trung gian. Do đó, các nhóm thế trong mỗi trường hợp độc lập với nhau hoặc tốt hơn là ở dạng kết hợp, có nghĩa như xác định ở đây.

Các quy trình mô tả nêu trên có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc ở dạng kết hợp với chất khác để thu được các hợp chất có công thức I.

Các N-oxit có thể được điều chế từ các hợp chất theo sáng chế theo các phương pháp oxy hóa thông thường, ví dụ, bằng cách xử lý các hợp chất I với peraxit hữu cơ như axit metacloperbenzoic (xem WO 03/64572 hoặc J. Med. Chem. 38(11), 1892-903, 1995); hoặc với chất oxy hóa vô cơ như hydro peroxit (xem J. Heterocyc. Chem. 18(7), 1305-8, 1981) hoặc oxon (xem J. Am. Chem. Soc. 123(25), 5962-5973, 2001). Phản ứng oxy hóa có thể dẫn đến các mono-N-oxit tinh khiết hoặc hỗn hợp của các N-oxit khác nhau, mà có thể được tách bằng các phương pháp thông thường như phương pháp sắc ký.

Trừ khi có quy định khác, thuật ngữ “(các) hợp chất theo sáng chế” hoặc “(các) hợp chất của sáng chế” hoặc “(các) hợp chất có công thức (I)”, chỉ các hợp chất có công thức I.

Thuật ngữ “(các) hợp chất theo sáng chế”, hoặc “các hợp chất có công thức I” gồm (các) hợp chất như được định nghĩa ở đây cũng như chất đồng phân lập thể, muối, chất hỗ biến

hoặc N-oxit của chúng. Thuật ngữ "(các) hợp chất của sáng chế" được hiểu là tương đương với thuật ngữ "(các) hợp chất theo sáng chế, vì vậy cũng bao gồm chất đồng phân lập thể, muối, chất hồ biến hoặc N-oxit của nó.

Thuật ngữ "(các) chế phẩm theo sáng chế" hoặc "(các) chế phẩm của sáng chế" bao hàm (các) chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất có công thức I theo sáng chế như được định nghĩa trên đây. Các chế phẩm của sáng chế tốt hơn là các chế phẩm dùng trong nông nghiệp hoặc trong thú y.

Tùy thuộc vào kiểu thể, các hợp chất theo sáng chế có thể có một hoặc nhiều tâm bất đối, trong trường hợp đó chúng có mặt ở dạng hỗn hợp gồm các chất đồng phân đối ảnh hoặc các chất đồng phân không đối quang. Sáng chế đề xuất cả chất đồng phân đối ảnh tinh khiết riêng lẻ hoặc chất đồng phân không đối quang tinh khiết của các hợp chất theo sáng chế, và hỗn hợp của chúng và việc sử dụng theo sáng chế chất đồng phân đối ảnh tinh khiết hoặc chất đồng phân không đối quang tinh khiết của các hợp chất theo sáng chế hoặc hỗn hợp của chúng. Hợp chất thích hợp theo sáng chế cũng bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể hình học khả dĩ (các chất đồng phân cis/trans) và hỗn hợp của chúng. Các chất đồng phân cis/trans có thể có mặt 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 chất đồng phân đối ảnh hoặc chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân không đối quang tồn tại nhờ có nhiều hơn một tâm không đối xứng trong phân tử, cũng như chất đồng phân hình học (chất đồng phân cis/trans). Sáng chế đề xuất mọi chất đồng phân lập thể khả dĩ của các hợp chất có công thức I, nghĩa là các chất đồng phân đối ảnh hoặc các chất đồng phân không đối quang riêng lẻ, cũng như các hỗn hợp của chúng.

Các hợp chất theo sáng chế có thể là vô định hình hoặc có thể tồn tại ở một hoặc nhiều trạng thái kết tinh khác nhau (dạng đa hình) mà có thể có các đặc tính vĩ mô khác nhau như độ ổn định hoặc thể hiện các đặc tính sinh học khác nhau như các hoạt tính. Sáng chế đề cập đến các hợp chất theo sáng chế ở dạng vô định hình và dạng tinh thể, hỗn hợp gồm các trạng thái tinh thể khác nhau của các hợp chất tương ứng theo sáng chế, cũng như các muối vô định hình hoặc tinh thể của chúng nó.

Các muối của các hợp chất theo sáng chế tốt hơn là các muối có thể chấp nhận được trong nông nghiệp và/hoặc trong thú y, tốt hơn là các muối có thể chấp nhận được trong nông

nghiệp. Chúng có thể được tạo thành theo phương pháp thông thường, ví dụ bằng cách cho hợp chất phản ứng với axit của anion được nói đến nếu hợp chất theo sáng chế có nhóm chức bazơ hoặc bằng cách cho hợp chất có tính axit theo sáng chế phản ứng với bazơ thích hợp.

Muối hữu dụng trong thú y và/hoặc trong nông nghiệp của hợp chất theo sáng chế bao gồm đặc biệt là muối cộng axit của các axit mà các cation và các anion của chúng lần lượt là không có ảnh hưởng bất lợi đến hoạt tính diệt sinh vật gây hại của các hợp chất theo sáng chế.

Các cation thích hợp cụ thể là các ion của các kim loại kiềm, tốt hơn là Li, Na và K, của các kim loại kiềm thổ, tốt hơn là Ca, Mg và Ba, và của các kim loại chuyển tiếp, tốt hơn là Mn, Cu, Zn và Fe, và cả amoni (NH_4^+) và amoni được thế trong đó một đến bốn nguyên tử H được thay thế bằng C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -hydroxyalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, hydroxy- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, phenyl hoặc benzyl. Ví dụ về các ion amoni được thế bao gồm metylamoni, isopropylamoni, dimethylamoni, diisopropylamoni, trimethylamoni, tetramethylamoni, tetraethylamoni, tetrabutylamoni, 2-hydroxyethylamoni, 2-(2-hydroxyetoxy)ethylamoni, bis(2-hydroxyetyl)amoni, benzyltrimethylamoni và triethylamoni, ngoài ra các ion phosphoni, ion sulfoni, tốt hơn là các ion tri(C_1C_4 alkyl)sulfoni, và sulfoxoni, tốt hơn là tri(C_1 - C_4 -alkyl)sulfoxoni.

Các anion của muối cộng axit hữu dụng trước tiên là clorua, bromua, florua, hydrosulfat, sulfat, dihydrophosphat, hydrophosphat, phosphat, nitrat, bicarbonat, cacbonat, hexaflorsilicat, hexaflorophosphat, benzoat, và các anion của axit C_1 - C_4 -alkanoic, tốt hơn là format, axetat, propionat và butyrat. Chúng có thể được tạo thành bằng cách cho các hợp chất theo sáng chế phản ứng với axit có anion tương ứng, tốt hơn là với axit clohydric, axit bromhydric, axit sulfuric, axit phosphoric hoặc axit nitric.

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

Các gốc hữu cơ nêu trong định nghĩa về các tham biến trên đây - như thuật ngữ halogen - là thuật ngữ chung cho các danh sách riêng biệt của các thành phần nhóm riêng biệt. Tiền tố C_n - C_m trong mỗi trường hợp chỉ ra số nguyên tử cacbon có thể có trong nhóm này.

Thuật ngữ "halogen" trong mỗi trường hợp để chỉ F, Br, Cl hoặc I, cụ thể là F, Br hoặc Cl.

Thuật ngữ "alkyl" như được sử dụng ở đây và trong phần alkyl của alkylamino,

alkylcarbonyl, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl và alkoxyalkyl trong mỗi trường hợp chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh thường có từ 1 đến 10 nguyên tử cacbon, thường là từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là 1 đến 4 nguyên tử cacbon, tốt hơn nữa là từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon. Ví dụ về nhóm alkyl là CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, iso-propyl, n-butyl, 2-butyl, iso-butyl, tert-butyl, n-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 3-metylbutyl, 2,2-dimetylpropyl, 1-etylpropyl, n-hexyl, 1,1-dimetylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, 1-metypentyl, 2-metypentyl, 3-metypentyl, 4-metypentyl, 1,1-dimetylbutyl, 1,2-dimetylbutyl, 1,3-dimetylbutyl, 2,2-dimetylbutyl, 2,3-dimetylbutyl, 3,3-dimetylbutyl, 1-etylbutyl, 2-etylbutyl, 1,1,2-trimetylpropyl, 1,2,2-trimetylpropyl, 1-etyl-1-metylpropyl, và 1-etyl-2-metylpropyl.

Thuật ngữ "haloalkyl" như được sử dụng ở đây và trong phần gốc haloalkyl của haloalkylcarbonyl, haloalkoxycarbonyl, haloalkylthio, haloalkylsulfonyl, haloalkylsulfinyl, haloalkoxy và haloalkoxyalkyl, trong mỗi trường hợp chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh thường có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, trong đó các nguyên tử H thuộc nhóm này được thay thế một phần hoặc hoàn toàn bằng các nguyên tử halogen. Các gốc haloalkyl được ưu tiên được chọn từ C_1 - C_4 -haloalkyl, tốt hơn là từ C_1 - C_3 -haloalkyl hoặc C_1 - C_2 -haloalkyl, cụ thể là từ C_1 - C_2 -floalkyl như flometyl, diflometyl, triflometyl, 1-floetyl, 2-floetyl, 2,2-difloetyl, 2,2,2-trifloetyl, pentafloretyl, và các gốc tương tự.

Thuật ngữ "alkoxy" như được sử dụng ở đây trong mỗi trường hợp biểu thị nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh mà được liên kết thông qua nguyên tử oxy và thường có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Ví dụ về nhóm alkoxy là metoxy, etoxy, n-propoxy, iso-propoxy, n-butyloxy, 2-butyloxy, iso-butyloxy, tert.-butyloxy, và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ "alkoxyalkyl" như được sử dụng ở đây để chỉ alkyl thường có từ 1 đến 4, tốt hơn là 1 đến 2 nguyên tử cacbon, trong đó 1 nguyên tử cacbon mang gốc alkoxy thường có từ 1 đến 4, tốt hơn là 1 hoặc 2 nguyên tử cacbon như được định nghĩa trên đây. Ví dụ về alkoxyalkyl là CH_2OCH_3 , $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$, 2-(metoxy)etyl, và 2-(etoxi)etyl.

Thuật ngữ "haloalkoxy" như được sử dụng ở đây trong mỗi trường hợp biểu thị nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, trong đó các nguyên tử H của nhóm này được thay thế một phần hoặc hoàn

toàn bằng các nguyên tử halogen, cụ thể là các nguyên tử flo. Các gốc haloalkoxy được ưu tiên bao gồm C₁-C₄-haloalkoxy, cụ thể là C₁-C₂-floalkoxy, như flometoxy, diflometoxy, triflometoxy, 1-floetoxo, 2-floetoxo, 2,2-difloetoxo, 2,2,2-trifloetoxo, 2-clo-2-floetoxo, 2-clo-2,2-diflo-etoxy, 2,2-diclo-2-floetoxo, 2,2,2-tricloetoxo, pentaflorotoxo và gốc tương tự.

Thuật ngữ "alkylthio" (alkylsulfanyl: alkyl-S-) như được sử dụng ở đây chỉ nhóm alkyl no mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là 1 đến 4 nguyên tử cacbon (= C₁-C₄-alkylthio), tốt hơn nữa là 1 đến 3 nguyên tử cacbon, được gắn vào thông qua nguyên tử lưu huỳnh. Ví dụ bao gồm metylthio, etylthio, propylthio, isopropylthio, và n-butylthio.

Thuật ngữ "haloalkylthio" như được sử dụng ở đây để chỉ nhóm alkylthio như đã nêu ở trên trong đó các nguyên tử H được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng flo, clo, brom và/hoặc iot. Ví dụ bao gồm 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 pentafloretylthio và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ "alkylsulfinyl" (alkylsulfoxyl: C₁-C₆-alkyl-S(=O)-), như được sử dụng ở đây chỉ nhóm alkyl no mạch thẳng hoặc mạch nhánh (như nêu trên) có 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon (= C₁-C₄-alkylsulfinyl), tốt hơn nữa là từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon được liên kết thông qua nguyên tử lưu huỳnh của nhóm sulfinyl ở vị trí bất kỳ trong nhóm alkyl.

Thuật ngữ "alkylsulfonyl" (alkyl-S(=O)₂-) như được sử dụng trong bản mô tả đề cập đến nhóm alkyl no mạch thẳng hoặc mạch nhánh có 1 đến 6 nguyên tử cacbon, tốt hơn là 1 đến 4 nguyên tử cacbon (= C₁-C₄-alkylsulfonyl), tốt hơn là 1 đến 3 nguyên tử cacbon, mà được liên kết thông qua nguyên tử lưu huỳnh của nhóm sulfonyl ở vị trí bất kỳ trong nhóm alkyl.

Thuật ngữ "alkoxycarbonyl" đề cập đến nhóm alkylcarbonyl như được xác định trên đây, được liên kết thông qua nguyên tử oxy với phần còn lại của phân tử.

Thuật ngữ "alkenyl" như được sử dụng ở đây trong mỗi trường hợp biểu thị gốc hydrocarbon không bão hòa đơn thường có 2 đến 6, tốt hơn là 2 đến 4 nguyên tử cacbon, trong đó liên kết đôi có thể có mặt ở vị trí bất kỳ, ví dụ vinyl, alyl (2-propen-1-yl), 1-propen-1-yl,

2-propen-2-yl, metyl (2-metylprop-2-en-1-yl), 2-buten-1-yl, 3-buten-1-yl, 2-penten-1-yl, 3-penten-1-yl, 4-penten-1-yl, 1-metylbut-2-en-1-yl, 2-etylprop-2-en-1-yl và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ "haloalkenyl" như được sử dụng ở đây để chỉ nhóm alkenyl như được định nghĩa trên đây, trong đó các nguyên tử H được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng các nguyên tử halogen.

Thuật ngữ "alkynyl" như được sử dụng ở đây trong mỗi trường hợp biểu thị gốc hydrocarbon không bão hòa đơn thường có 2 đến 6, tốt hơn là 2 đến 4 nguyên tử cacbon, trong đó liên kết ba có thể có mặt ở vị trí bất kỳ, ví dụ, etynyl, propargyl (2-propyn-1-yl), 1-propyn-1-yl, 1-metylprop-2-yn-1-yl, 2-butyn-1-yl, 3-butyn-1-yl, 1-pentyn-1-yl, 3-pentyn-1-yl, 4-pentyn-1-yl, 1-metylbut-2-yn-1-yl, 1-etylprop-2-yn-1-yl và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ "haloalkynyl" như được sử dụng ở đây để chỉ nhóm haloalkynyl như được định nghĩa trên đây, trong đó các nguyên tử H được thay thế một phần hoặc hoàn toàn bằng các nguyên tử halogen.

Thuật ngữ "xycloalkyl" như được sử dụng ở đây và trong gốc xycloalkyl của xycloalkoxy và xycloalkylthio trong mỗi trường hợp chỉ gốc vòng béo một vòng thường có từ 3 đến 8 hoặc từ 3 đến 6 nguyên tử cacbon, như xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl, xyclooctyl, xyclononyl và xyclodexyl hoặc xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl.

Thuật ngữ "haloxycloalkyl" như được sử dụng ở đây và trong các gốc haloxycloalkyl của haloxycloalkoxy và haloxycloalkylthio trong mỗi trường hợp biểu thị gốc một vòng vòng béo thường có từ 3 đến 8 nguyên tử C hoặc 3 đến 6 nguyên tử C, trong đó ít nhất một, ví dụ 1, 2, 3, 4 hoặc 5 nguyên tử H, được thay thế bằng halogen, cụ thể là bằng flo hoặc clo. Các ví dụ là 1- và 2- floxyclopropyl, 1,2-, 2,2- và 2,3-difloxyclopropyl, 1,2,2-trifloxyclopropyl, 2,2,3,3-tetrafloxypropyl, 1- và 2-cloxypropyl, 1,2-, 2,2- và 2,3-dicloxypropyl, 1,2,2-tricloxypropyl, 2,2,3,3-tetracloxypropyl, 1,2- và 3-floxypropyl, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-difloxypropyl, 1,2- và 3-cloxypropyl, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-dicloxypropyl và gốc tương tự.

Thuật ngữ "xycloalkenyl" như được sử dụng ở đây và trong gốc xycloalkenyl của xycloalkenylloxy và xycloalkenylthio trong mỗi trường hợp biểu thị gốc không thơm không bão hòa đơn một vòng thường có từ 3 đến 8, chẳng hạn 3 hoặc 4 hoặc từ 5 đến 10 nguyên tử

cacbon, tốt hơn là từ 3 đến 8 nguyên tử cacbon. Ví dụ về các nhóm xycloalkenyl bao gồm xyclopropenyl, xycloheptenyl hoặc xyclooctenyl.

Thuật ngữ “được thế” nếu không có quy định khác, để chỉ việc được thế bằng 1, 2 hoặc số lượng tối đa có thể có của các nhóm thế. Nếu các nhóm thế như được định nghĩa trong các hợp chất có công thức I là nhiều hơn một thì chúng là độc lập với nhau và là giống hoặc khác nhau nếu không được nêu theo cách khác.

Thuật ngữ “vòng cacbon” hoặc “carboxycyl” nói chung bao gồm, trừ khi có quy định khác, vòng không thơm một vòng có 3 đến 12 cạnh, tốt hơn là 3 đến 8 cạnh hoặc 5 đến 8 cạnh, tốt hơn nữa là 5 hoặc 6 cạnh có 3 đến 12, tốt hơn là 3 đến 8 hoặc 5 đến 8, tốt hơn nữa là 5 hoặc 6 nguyên tử cacbon. Tốt hơn là, thuật ngữ “vòng cacbon” bao gồm các nhóm xycloalkyl và xycloalkenyl như được định nghĩa trên đây, ví dụ, các vòng xyclopropan, xyclobutan, xyclopentan và xyclohexan.

Thuật ngữ “dị vòng” hoặc “heteroxycyl” nói chung bao gồm, trừ khi có quy định khác, các gốc dị vòng không thơm một vòng có 3 đến 10 cạnh, tốt hơn là 3 đến 8 cạnh hoặc 5 đến 8 cạnh, tốt hơn nữa là 5 hoặc 6 cạnh, cụ thể là 6 cạnh. Các gốc dị vòng không thơm này thường chứa 1, 2, 3, 4 hoặc 5, tốt hơn là 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S làm thành phần của vòng, trong đó nguyên tử S làm thành phần của vòng có thể có mặt ở dạng S, SO hoặc SO₂. Nếu không được nêu theo cách đối lập, các nguyên tử N và S của dị vòng có thể được oxy hóa. Ví dụ về các gốc dị vòng có 5 hoặc 6 cạnh bao gồm các dị vòng không thơm, bão hòa hoặc chưa bão hòa, như oxiranyl, oxetanyl, thietanyl, thietanyl-S-oxid (S-oxothietanyl), thietanyl-S-dioxid (S-dioxothietanyl), pyrrolidinyl, pyrolinyl, pyrazolinyl, tetrahydrofuranyl, dihydrofuranyl, 1,3-dioxolanyl, thiolanyl, S-oxothiolanyl, S-dioxothiolanyl, dihydrothienyl, S-oxodihydrothienyl, S-dioxodihydrothienyl, oxazolidinyl, oxazolinyl, thiazolinyl, oxathiolanyl, piperidinyl, piperazinyl, pyranyl, dihydropyranyl, tetrahydropyranyl, 1,3- và 1,4-dioxanyl, thiopyranyl, S.oxothiopyranyl, S-dioxothiopyranyl, dihydrothiopyranyl, S-oxodihydrothiopyranyl, S-dioxodihydrothiopyranyl, tetrahydrothiopyranyl, S-oxotetrahydrothiopyranyl, S-dioxotetrahydrothiopyranyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, S-oxothiomorpholinyl, S-dioxothiomorpholinyl, thiazinyl và các gốc tương tự. Ví dụ về các dị vòng còn chứa các nhóm 1 hoặc 2 carbonyl làm thành phần của vòng bao gồm pyrrolidin-2-onyl, pyrrolidin-2,5-dionyl, imidazolidin-2-onyl, oxazolidin-2-

onyl, thiazolidin-2-onyl và các nhóm tương tự.

Thuật ngữ “dị vòng không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn” hoặc “vòng dị vòng không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn” dùng để chỉ dị vòng mà không bão hòa một phần hoặc dị vòng mà không bão hòa hoàn toàn. Dị vòng không bão hòa một phần gồm các gốc dị vòng không bão hòa, một vòng có 3 hoặc 6 cạnh chứa 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại làm thành phần của vòng được chọn từ N, O và S. Các ví dụ về các dị vòng không bão hòa một phần có 3 đến 6- cạnh gồm azirin, oxeteen, dihydropyrol, dihydrofuran, dihydrothiophen, dihydrooxazol, dihydroimidazol, dihydrothiazol, tetrahydropyrazin, dihydrooxazin. Dị vòng không bão hòa hoàn toàn bao gồm các gốc dị vòng không bão hòa đơn vòng 5 hoặc 6 cạnh chứa 1, 2, 3 hoặc 4 nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S làm thành phần của vòng. Ví dụ về các dị vòng không bão hòa hoàn toàn có 5 hoặc 6 cạnh gồm pyridyl, tức là 2-, 3-, hoặc 4-pyridyl, pyrimidinyl, tức là 2-, 4- hoặc 5-pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl, tức là 3- hoặc 4-pyridazinyl, thienyl, tức là 2- hoặc 3-thienyl, furyl, tức là 2- hoặc 3-furyl, pyrolyl, tức là 2- hoặc 3-pyrolyl, oxazolyl, tức là 2-, 3- hoặc 5-oxazolyl, isoxazolyl, tức là 3-, 4- hoặc 5-isoxazolyl, thiazolyl, tức là 2-, 3- hoặc 5-thiazolyl, isothiazolyl, tức là 3-, 4- hoặc 5-isothiazolyl, pyrazolyl, tức là 1-, 3-, 4- hoặc 5-pyrazolyl, tức là 1-, 2-, 4- hoặc 5-imidazolyl, oxadiazolyl, ví dụ 2- hoặc 5-[1,3,4]oxadiazolyl, 4- hoặc 5-(1,2,3-oxadiazol)yl, 3- hoặc 5-(1,2,4-oxadiazol)yl, 2- hoặc 5-(1,3,4-thiadiazol)yl, thiadiazolyl, ví dụ 2- hoặc 5-(1,3,4-thiadiazol)yl, 4- hoặc 5-(1,2,3-thiadiazol)yl, 3- hoặc 5-(1,2,4-thiadiazol)yl, triazolyl, ví dụ 1H-, 2H- hoặc 3H-1,2,3-triazol-4-yl, 2H-triazol-3-yl, 1H-, 2H-, hoặc 4H-1,2,4-triazolyl và tetrazolyl, tức là 1H- hoặc 2H-tetrazolyl. Thuật ngữ “dị vòng không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn” hoặc “vòng dị vòng không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn” còn bao gồm các gốc dị vòng không bão hòa một phần hoặc hoàn toàn hai vòng có 8 đến 10 cạnh chứa 1, 2 hoặc 3 nguyên tử khác loại được chọn từ N, O và S làm thành phần của vòng, trong đó vòng dị vòng 5 hoặc 6 cạnh được ngưng tụ tạo thành vòng phenyl hoặc thành gốc dị vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh. Ví dụ về dị vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh được ngưng tụ với vòng phenyl hoặc với gốc dị vòng thơm 5 hoặc 6 cạnh bao gồm benzofuranyl, benzothienyl, indolyl, indazolyl, benzimidazolyl, benzoxathiazolyl, benzoxadiazolyl, benzothiadiazolyl, benzoxazinyl, chinoliny, isochinoliny, purinyl, 1,8-naphtyridyl, pteridyl, pyrido[3,2-d]pyrimidyl hoặc pyridoimidazolyl và các dị vòng tương tự. Các gốc hetaryl ngưng tụ này có thể được liên kết

với phần còn lại của phân tử nhờ nguyên tử vòng bất kỳ của dị vòng thom 5 hoặc 6 cạnh hoặc nhờ nguyên tử cacbon của gốc phenyl ngưng tụ.

Thuật ngữ oxo (=O) làm phân tử thế dùng để chỉ việc thay thế hai H bằng gốc oxo (=O).

Thuật ngữ “heteroaryl” dùng để chỉ “dị vòng không bão hòa hoàn toàn”.

Thuật ngữ “alkylen”, “alkenylen”, và “alkynylen” chỉ alkyl, alkenyl, và alkynyl lần lượt như được định nghĩa trên đây, được liên kết với phần còn lại của phân tử thông qua hai nguyên tử, tốt hơn là thông qua hai nguyên tử cacbon, của nhóm tương ứng, sao cho chúng thể hiện là nhóm liên kết giữa hai gốc của phân tử. Cụ thể là, thuật ngữ “alkylen” có thể dùng để chỉ chuỗi alkyl như $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, và $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$. Tương tự, “alkenylen” và “alkynylen” có thể lần lượt dùng để chỉ các chuỗi alkenyl và alkynyl.

Thuật ngữ “CN” dùng để chỉ nhóm xyano.

Liên quan tới các tham biến, các phương án được ưu tiên cụ thể của các hợp chất có công thức I được đưa ra dưới đây.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, X là O.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, X là S.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^x được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl và C_3 - C_6 haloxycloalkyl.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^x được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_1 - C_6 -haloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^x được chọn từ CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo phương án được đặc biệt ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^x là CH_3 hoặc C_2H_5 .

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^x được chọn từ $\text{C}(\text{O})-\text{OR}^a$, NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen- NR^bR^c , $\text{O}-\text{C}_1$ - C_6 -alkylen- NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen-CN,

$\text{NH-C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen-NR}^b\text{R}^c$, $\text{C(O)-NR}^b\text{R}^c$, C(O)-R^d , $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$, $\text{S(=O)}_m\text{R}^e$, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^1 được chọn từ $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylsulfenyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylsulfinyl}$, và $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylsulfonyl}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn;

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn, tốt hơn là $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, cụ thể là $\text{C}_1\text{-C}_2\text{-alkyl}$ như CF_3 , CF_2CF_3 và $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là H.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn, tốt hơn là $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, cụ thể là $\text{C}_1\text{-C}_2\text{-alkoxy}$ như OCF_3 , OCH_2CHF_2 và OCH_2CF_3 .

Theo phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$ hoặc $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyl}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn.

Theo phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkyl}$ hoặc $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkoxy}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn.

Theo phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^1 là $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-sulfenyl}$ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn như SCF_3 , $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-sulfinyl}$ như S(=O)CF_3 hoặc $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-sulfonyl}$ như $\text{S(=O)}_2\text{CF}_3$.

Theo phương án được ưu tiên hơn về các hợp chất có công thức I, R^1 là CF_3 , CF_2CF_3 , OCHF_2 , $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$, SCF_3 , OCF_3 , S(=O)CF_3 hoặc $\text{S(=O)}_2\text{CF}_3$.

Theo phương án được đặc biệt ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^1 là CF_3 , CF_2CF_3 , $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$, SCF_3 , OCF_3 , S(=O)CF_3 hoặc $\text{S(=O)}_2\text{CF}_3$.

Theo phương án cụ thể của các hợp chất có công thức I, R^1 là CF_3 , CF_2CF_3 , OCHF_2 , hoặc OCF_3 .

Theo phương án cụ thể của các hợp chất có công thức I, R^1 là CF_3 .

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^2 được chọn từ H, CN, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-xycloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkoxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-haloalkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-haloalkynyl}$ và $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-haloxycloalkyl}$.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^2 được chọn từ H, halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_3 - C_6 -xycloalkoxy;

Theo phương án được ưu tiên hơn về các hợp chất có công thức I, R^2 được chọn từ H, CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^2 được chọn từ H, CH_3 và C_2H_5 .

Theo phương án được đặc biệt ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^2 là H.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^3 được chọn từ H, CN, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl và C_3 - C_6 haloxycloalkyl.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^3 được chọn từ H, halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_3 - C_6 -xycloalkoxy.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^3 được chọn từ H, CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^2 được chọn từ H, CH_3 và C_2H_5 .

Theo phương án được đặc biệt ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^3 là H.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^a được chọn từ H, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl và C_3 - C_6 haloxycloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^a được chọn từ H, CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^b được chọn từ H, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 haloxycloalkyl, $-(C=O)R$, $-C(=O)OR$, và $-C(=O)NR$.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^b được chọn từ H, CH_3 , C_2H_5 , n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^c được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆- haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, và C₃-C₆ haloxyaloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^c được chọn từ H, CH₃, C₂H₅, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^d được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆- haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl và C₃-C₆ haloxyaloalkyl.

Theo một phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^d được chọn từ H, CH₃, C₂H₅, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^e được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, và C₃-C₆ haloxyaloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^e được chọn từ CH₃, C₂H₅, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl và propargyl.

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^f được chọn từ halogen, CN, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl và C₃-C₆ haloxyaloalkyl.

Theo phương án được ưu tiên hơn về các hợp chất có công thức I, R^f được chọn từ Cl, F, Br, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, CN, CH₃, C₂H₅, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, alyl, propargyl, CF₃, CHF₂, và CF₂CF₃.

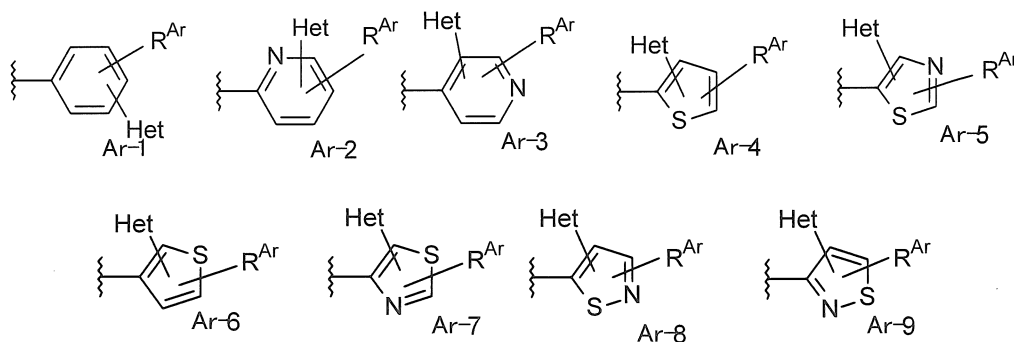
Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, Ar là phenyl.

Theo phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, Ar là heteroaryl.

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Ar là heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh chứa một nguyên tử khác loại được chọn từ O, N, và S.

Theo phương án được ưu tiên hơn về hợp chất có công thức I, trong đó Ar là phenyl hoặc heteroaryl 5-6 cạnh được thế bằng S(=O)_mR^e ở vị trí ortho so với liên kết mà gắn với heteroaryl 9 cạnh của hợp chất có công thức I, và tùy ý được thế tiếp bằng 1 hoặc 1 R^{Ar}, tốt hơn là được chọn từ halogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, phenyl, và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, Ar được chọn từ công thức Ar-1 đến Ar-9, trong đó công thức Ar-1 đến Ar-9 được thế bằng Het và 1, hoặc 2 R^{Ar} , với điều kiện Het và R^{Ar} được gắn với các nguyên tử cacbon khác nhau, và trong đó một phần tử thế R^{Ar} là ưu tiên ở vị trí ortho để liên kết --- ;



Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, Ar là pyridinyl hoặc thiophenyl được thế bằng R^{Ar} khi $S(=O)_mR^e$ ở vị trí ortho để liên kết nối với heteroaryl 9 cạnh của hợp chất có công thức I, và tùy ý được thế tiếp bằng 1 R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, phenyl, và benzyl, trong đó R^{Ar} không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f ;

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, $S(=O)_mR^e$, phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f .

Theo một phương án được ưu tiên hơn về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, $S(=O)_mR^e$, phenyl, và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f .

Theo một phương án được ưu tiên về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, và C_1 - C_6 -haloalkoxy.

Theo một phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -haloxycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy và C_3 - C_6 -haloxycloalkoxy.

Theo phương án được ưu tiên khác về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ C_1 - C_6 -sulfenyl, C_1 - C_6 -sulfinyl và C_1 - C_6 -sulfonyl.

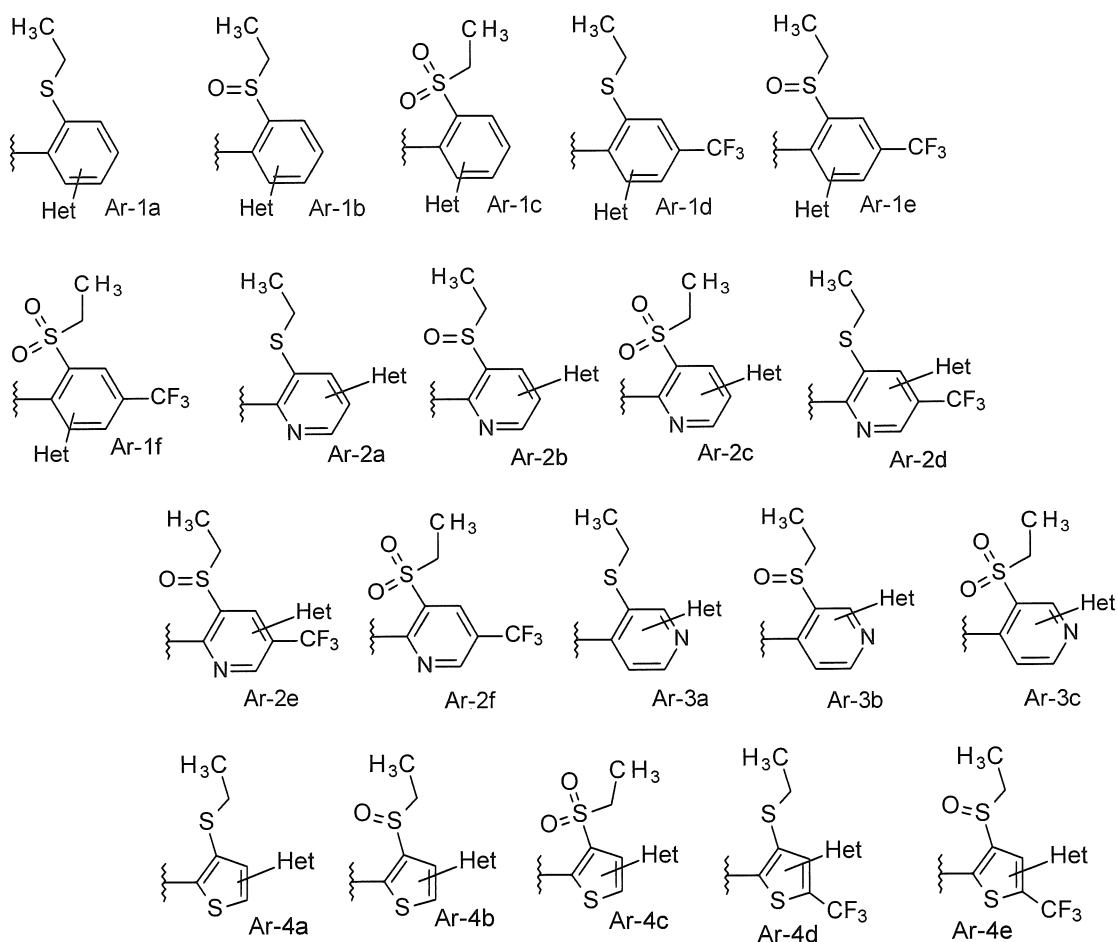
Theo phương án được ưu tiên hơn về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} được chọn từ Cl, F, Br, CH₃, SCH₃, SC₂H₅, S(=O)CH₃, S(=O)C₂H₅, S(=O)₂CH₃, S(=O)₂C₂H₅.

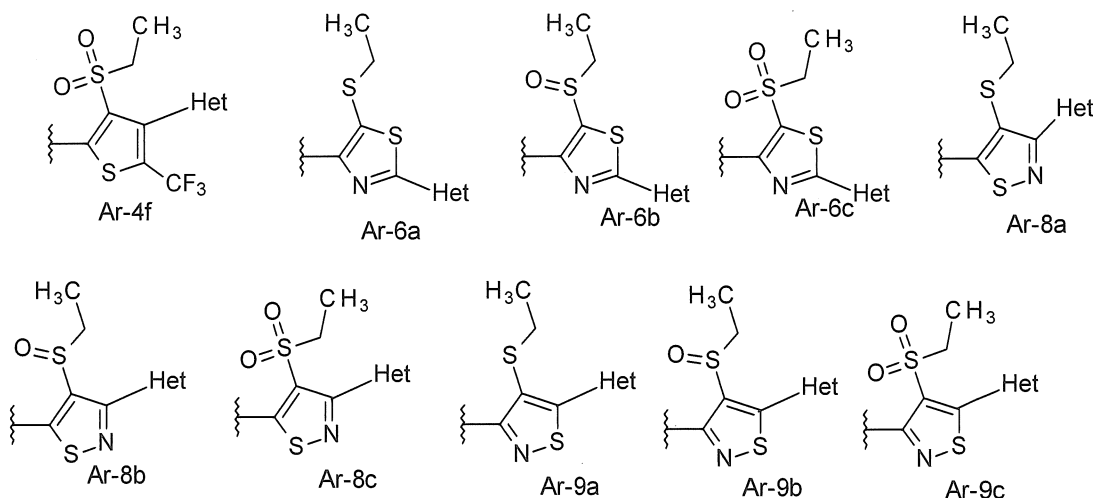
Theo phương án được ưu tiên nhất về các hợp chất có công thức I, R^{Ar} là S(=O)₂C₂H₅.

Theo một phương án được ưu tiên về hợp chất có công thức I, n bằng 1 hoặc 2.

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, n bằng 1.

Theo một phương án được đặc biệt ưu tiên về hợp chất có công thức I, Ar được chọn từ nhóm công thức Ar-1a đến Ar-1f, Ar-2a đến Ar-2f, Ar-3a đến Ar-3c, Ar-4a đến Ar-4f, Ar-6a đến Ar-6c, Ar-8a đến Ar-8c, và Ar-9a đến Ar-9c:





Theo một phương án được ưu tiên về hợp chất có công thức I, Het bằng heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh mà không được thế hoặc được thế bằng R;

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het bằng heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh mà được thế bằng R;

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het bằng heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh mà không được thế.

Theo một phương án được ưu tiên về hợp chất có công thức I, Het là heterocyclyl có 5 hoặc 6 cạnh mà không được thế hoặc được thế bằng R;

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het là heterocyclyl có 5 hoặc 6 cạnh mà được thế bằng R;

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het là heterocyclyl có 5 hoặc 6 cạnh mà không được thế.

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, tetrazolyl, và thiadiazolyl; trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R.

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, tetrazolyl, và thiadiazolyl; trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R.

Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het được chọn từ thiophenyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, pyrazolyl, triazolyl, và tetrazolyl; trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R.

Theo một phương án được ưu tiên về hợp chất có công thức I, R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

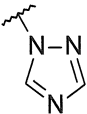
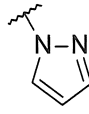
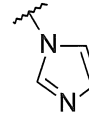
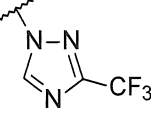
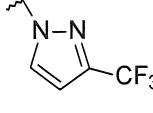
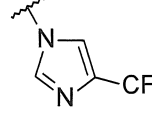
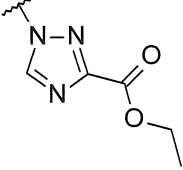
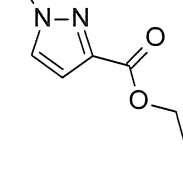
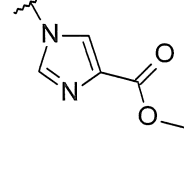
Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

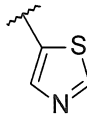
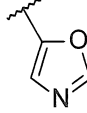
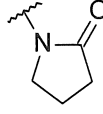
Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, R được chọn từ halogen, oxo (=O), và C₁-C₆-haloalkyl.

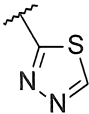
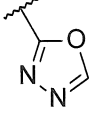
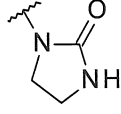
Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, R được chọn từ C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, phenyl, heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh, hoặc heteroxyclyl có 5 hoặc 6 cạnh, trong đó các nhóm vòng của R không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f;

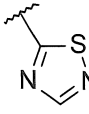
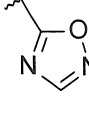
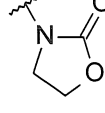
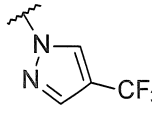
Theo một phương án được ưu tiên khác về hợp chất có công thức I, Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, tetrazolyl, và thiadiazolyl; trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R được chọn từ halogen, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

Các ví dụ về Het được ưu tiên cụ thể được liệt kê trong Bảng H dưới đây,

Het số	Cấu trúc Het	Het số	Cấu trúc Het	Het số	Cấu trúc Het
Het-1.		Het-4.		Het-7.	
Het-2.		Het-5.		Het-8.	
Het-3.		Het-6.		Het-9.	

Het số	Cấu trúc Het
Het-10.	
Het-11.	
Het-12.	

Het số	Cấu trúc Het
Het-13.	
Het-14.	
Het-15.	

Het số	Cấu trúc Het
Het-16.	
Het-17.	
Het-18.	
Het-19.	

Theo một phương án được ưu tiên hơn về hợp chất có công thức I, trong đó

Het là như được định nghĩa ở đây;

R^x được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_1 - C_6 -haloalkyl;

R^1 được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfenyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, và C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn;

R^2 được chọn từ H, halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_3 - C_6 -xycloalkoxy;

R^3 được chọn từ H, halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, và C_3 - C_6 -xycloalkoxy;

Ar là phenyl hoặc heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh;

n bằng 1 hoặc 2;

R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, $S(=O)_mR^e$, phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

R^e được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, và C_3 - C_6 -haloxycloalkyl;

R^f được chọn từ halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, và C₂-C₆-alkynyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án được ưu tiên nhất về hợp chất có công thức I, trong đó

R^x là C₁-C₆-alkyl;

R^1 được chọn từ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, và C₁-C₆-alkylsulfonyl;

R^2 được chọn từ H, halogen, và C₁-C₆-alkyl;

R^3 được chọn từ H, halogen, và C₁-C₆-alkyl;

Ar là pyridinyl hoặc thiophenyl được thế bằng R^{Ar} khi S(=O)_mR^e ở vị trí ortho để liên kết nối với heteroaryl 9 cạnh của hợp chất có công thức I, và tùy ý được thế tiếp bằng 1 R^{Ar} được chọn từ halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, phenyl, và benzyl, trong đó R^{Ar} không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f ;

R^e được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, và C₃-C₆-haloxycloalkyl;

R^f được chọn từ halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, và C₂-C₆-alkynyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1, hoặc 2;

Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl; preferably thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl

trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R;

R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

Theo phương án được ưu tiên nhất khác về hợp chất có công thức I, trong đó

X là O;

R^1 là C₁-C₆-alkyl được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn;

R^x là C₁-C₆-alkyl;

R^2 là H;

R^3 là H hoặc C_1 - C_6 alkyl;

Het được chọn từ thiophenyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyrazolyl, pyridinyl, triazolyl, và tetrazolyl;

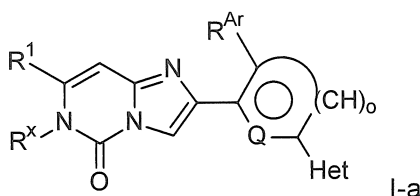
trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R;

R được chọn từ halogen, oxo (=O), và C_1 - C_6 -haloalkyl;

Ar là pyridinyl được thế bằng R^{Ar} khi $S(=O)_mR^e$ ở vị trí ortho để liên kết nối với heteroaryl 9 cạnh của hợp chất có công thức I;

R^e là C_1 - C_6 -alkyl.

Theo một phương án được ưu tiên cụ thể, hợp chất có công thức I tương ứng với hợp chất có công thức I-a,



trong đó vòng tròn trên vòng chứa Q biểu thị rằng vòng này là vòng thơm;

Q là S hoặc N;

R^x là C_1 - C_6 -alkyl;

R^1 được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfenyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, và C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn

R^{Ar} là $S(=O)_mR^e$; trong đó

R^e là C_1 - C_6 -alkyl;

Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl; tốt hơn là thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl

trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R;

R được chọn từ halogen, oxo (=O), C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, và C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl;

m bằng 0, 1, hoặc 2;

o bảng 1 hoặc 2,

Theo một phương án được ưu tiên cụ thể hơn về hợp chất có công thức I, hợp chất có công thức I là hợp chất có công thức I-a, trong đó

Q là S hoặc N;

R^x là CH₃ hoặc C₂H₅;

R¹ được chọn từ CF₃, CF₂CF₃, CF(CF₃)₂, SCF₃, OCF₃, OCHF₂, S(=O)CF₃, và S(=O)₂CF₃;

R^{Ar} là S-CH₃, S(=O)-CH₃, S(=O)₂-CH₃, S-C₂H₅, S(=O)-C₂H₅, hoặc S(=O)₂-C₂H₅;

Het được chọn từ Het-1 đến Het-19 từ bảng H;

o bảng 1 hoặc 2,

Ngoài ra, mỗi nhóm trong số các nhóm được đề cập đối với nhóm thế trong các bảng về thực chất còn là độc lập với dạng kết hợp trong đó nó được đề cập, khía cạnh được ưu tiên cụ thể của nhóm thế được đề cập đến.

Theo phương án được ưu tiên cụ thể hợp chất có công thức I, các hợp chất theo sáng chế là các hợp chất được đưa ra trong các Bảng 1-1 đến 1-18 trong đó nghĩa đối với dạng kết hợp của các tham biến R^x, R¹ và Het đối với mỗi hợp chất riêng rẽ của các bảng 1 đến 18 tương ứng với mỗi dòng của Bảng A. Mỗi nhóm trong số các nhóm đối với một phần tử thế trong các bảng này về thực chất còn là độc lập với dạng kết hợp trong đó nó được đề cập, khía cạnh được ưu tiên cụ thể của nhóm thế được đề cập đến.

Bảng 1-1 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-2 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S(=O)-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-3 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S(=O)₂-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-4 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S-C₂H₅ và o bằng 1.

Bảng 1-5 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S(=O)-C₂H₅ và o bằng 1.

Bảng 1-6 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là S, R^{Ar} là S(=O)₂-C₂H₅ và o bằng 1.

Bảng 1-7 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-8 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-9 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)₂-CH₃ và o bằng 1.

Bảng 1-10 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S-C₂H₅ và o bằng 1.

- Bảng 1-11 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)-C₂H₅ và o bằng 1.
- Bảng 1-12 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)₂-C₂H₅ và o bằng 1.
- Bảng 1-13 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S-CH₃ và o bằng 2.
- Bảng 1-14 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)-CH₃ và o bằng 2.
- Bảng 1-15 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)₂-CH₃ và o bằng 2.
- Bảng 1-16 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S-C₂H₅ và o bằng 2.
- Bảng 1-17 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)-C₂H₅ và o bằng 2.
- Bảng 1-18 Các hợp chất có công thức I-a trong đó Q là N, R^{Ar} là S(=O)₂-C₂H₅ và o bằng 2.

Bảng A:

Dòng	R ¹	R ^X	Het
A-1	CF ₃	CH ₃	Het-1
A-2	CF ₃	CH ₃	Het-2
A-3	CF ₃	CH ₃	Het-3
A-4	CF ₃	CH ₃	Het-4
A-5	CF ₃	CH ₃	Het-5
A-6	CF ₃	CH ₃	Het-6
A-7	CF ₃	CH ₃	Het-7
A-8	CF ₃	CH ₃	Het-8
A-9	CF ₃	CH ₃	Het-9
A-10	CF ₃	CH ₃	Het-10
A-11	CF ₃	CH ₃	Het-11
A-12	CF ₃	CH ₃	Het-12
A-13	CF ₃	CH ₃	Het-13
A-14	CF ₃	CH ₃	Het-14
A-15	CF ₃	CH ₃	Het-15
A-16	CF ₃	CH ₃	Het-16
A-17	CF ₃	CH ₃	Het-17
A-18	CF ₃	CH ₃	Het-18
A-19	CF ₃	CH ₃	Het-19
A-20	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-21	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-22	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-23	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-24	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-25	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-26	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-27	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-28	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-29	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10

Dòng	R ¹	R ^X	Het
A-30	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-31	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-32	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-33	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-34	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-35	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-36	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-37	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-38	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-39	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-1
A-40	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-2
A-41	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-3
A-42	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-4
A-43	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-5
A-44	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-6
A-45	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-7
A-46	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-8
A-47	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-9
A-48	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-10
A-49	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-11
A-50	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-12
A-51	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-13
A-52	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-14
A-53	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-15
A-54	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-16
A-55	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-17
A-56	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-18
A-57	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-19
A-58	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1

Dòng	R ¹	R ^X	Het
A-59	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-60	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-61	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-62	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-63	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-64	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-65	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-66	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-67	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-68	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-69	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-70	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-71	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-72	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-73	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-74	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-75	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-76	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-77	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-1
A-78	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-2
A-79	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-3
A-80	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-4
A-81	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-5
A-82	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-6
A-83	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-7
A-84	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-8
A-85	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-9
A-86	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-10
A-87	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-11
A-88	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-12
A-89	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-13
A-90	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-14
A-91	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-15
A-92	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-16
A-93	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-17
A-94	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-18
A-95	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-19
A-96	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-1
A-97	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-2
A-98	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-3
A-99	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-4
A-100	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-5

Dòng	R ¹	R ^X	Het
A-101	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-6
A-102	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-7
A-103	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-8
A-104	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-9
A-105	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-10
A-106	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-11
A-107	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-12
A-108	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-13
A-109	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-14
A-110	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-15
A-111	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-16
A-112	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-17
A-113	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-18
A-114	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-19
A-115	SCF ₃	CH ₃	Het-1
A-116	SCF ₃	CH ₃	Het-2
A-117	SCF ₃	CH ₃	Het-3
A-118	SCF ₃	CH ₃	Het-4
A-119	SCF ₃	CH ₃	Het-5
A-120	SCF ₃	CH ₃	Het-6
A-121	SCF ₃	CH ₃	Het-7
A-122	SCF ₃	CH ₃	Het-8
A-123	SCF ₃	CH ₃	Het-9
A-124	SCF ₃	CH ₃	Het-10
A-125	SCF ₃	CH ₃	Het-11
A-126	SCF ₃	CH ₃	Het-12
A-127	SCF ₃	CH ₃	Het-13
A-128	SCF ₃	CH ₃	Het-14
A-129	SCF ₃	CH ₃	Het-15
A-130	SCF ₃	CH ₃	Het-16
A-131	SCF ₃	CH ₃	Het-17
A-132	SCF ₃	CH ₃	Het-18
A-133	SCF ₃	CH ₃	Het-19
A-134	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-135	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-136	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-137	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-138	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-139	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-140	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-141	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-142	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-9

Dòng	R ¹	R ^x	Het
A-143	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-144	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-145	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-146	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-147	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-148	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-149	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-150	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-151	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-152	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-153	OCF ₃	CH ₃	Het-1
A-154	OCF ₃	CH ₃	Het-2
A-155	OCF ₃	CH ₃	Het-3
A-156	OCF ₃	CH ₃	Het-4
A-157	OCF ₃	CH ₃	Het-5
A-158	OCF ₃	CH ₃	Het-6
A-159	OCF ₃	CH ₃	Het-7
A-160	OCF ₃	CH ₃	Het-8
A-161	OCF ₃	CH ₃	Het-9
A-162	OCF ₃	CH ₃	Het-10
A-163	OCF ₃	CH ₃	Het-11
A-164	OCF ₃	CH ₃	Het-12
A-165	OCF ₃	CH ₃	Het-13
A-166	OCF ₃	CH ₃	Het-14
A-167	OCF ₃	CH ₃	Het-15
A-168	OCF ₃	CH ₃	Het-16
A-169	OCF ₃	CH ₃	Het-17
A-170	OCF ₃	CH ₃	Het-18
A-171	OCF ₃	CH ₃	Het-19
A-172	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-173	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-174	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-175	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-176	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-177	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-178	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-179	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-180	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-181	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-182	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-183	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-184	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-13

Dòng	R ¹	R ^x	Het
A-185	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-186	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-187	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-188	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-189	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-190	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-191	OCHF ₂	CH ₃	Het-1
A-192	OCHF ₂	CH ₃	Het-2
A-193	OCHF ₂	CH ₃	Het-3
A-194	OCHF ₂	CH ₃	Het-4
A-195	OCHF ₂	CH ₃	Het-5
A-196	OCHF ₂	CH ₃	Het-6
A-197	OCHF ₂	CH ₃	Het-7
A-198	OCHF ₂	CH ₃	Het-8
A-199	OCHF ₂	CH ₃	Het-9
A-200	OCHF ₂	CH ₃	Het-10
A-201	OCHF ₂	CH ₃	Het-11
A-202	OCHF ₂	CH ₃	Het-12
A-203	OCHF ₂	CH ₃	Het-13
A-204	OCHF ₂	CH ₃	Het-14
A-205	OCHF ₂	CH ₃	Het-15
A-206	OCHF ₂	CH ₃	Het-16
A-207	OCHF ₂	CH ₃	Het-17
A-208	OCHF ₂	CH ₃	Het-18
A-209	OCHF ₂	CH ₃	Het-19
A-210	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-1
A-211	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-2
A-212	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-3
A-213	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-4
A-214	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-5
A-215	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-6
A-216	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-7
A-217	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-8
A-218	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-9
A-219	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-10
A-220	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-11
A-221	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-12
A-222	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-13
A-223	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-14
A-224	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-15
A-225	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-16
A-226	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-17

Dòng	R ¹	R ^x	Het
A-227	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-18
A-228	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-19
A-229	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-1
A-230	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-2
A-231	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-3
A-232	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-4
A-233	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-5
A-234	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-6
A-235	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-7
A-236	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-8
A-237	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-9
A-238	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-10
A-239	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-11
A-240	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-12
A-241	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-13
A-242	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-14
A-243	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-15
A-244	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-16
A-245	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-17
A-246	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-18
A-247	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-19
A-248	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-1
A-249	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-250	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-251	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-252	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-253	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-254	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-255	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-256	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-257	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-258	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-259	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-260	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-261	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-262	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-263	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-264	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-265	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18

Dòng	R ¹	R ^x	Het
A-266	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-267	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-1
A-268	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-2
A-269	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-3
A-270	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-4
A-271	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-5
A-272	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-6
A-273	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-7
A-274	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-8
A-275	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-9
A-276	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-10
A-277	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-11
A-278	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-12
A-279	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-13
A-280	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-14
A-281	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-15
A-282	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-16
A-283	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-17
A-284	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-18
A-285	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-19
A-286	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-287	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-288	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-289	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-290	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-291	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-292	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-293	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-294	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-295	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-296	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-297	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-298	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-299	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-300	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-301	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-302	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-303	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-304	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19

Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “(các) hợp chất của sáng chế” hoặc “(các) hợp chất theo sáng chế” dùng để chỉ (các) hợp chất có công thức (I) như được xác định trên đây, mà còn dùng để chỉ “(các) hợp chất có công thức I” hoặc “(các) hợp chất I”, và bao gồm các muối, các chất hỗ biến, các chất đồng phân lập thể, và N-oxit của chúng.

Sáng chế còn đề cập đến hỗn hợp gồm ít nhất một hợp chất theo sáng chế với ít nhất một thành phần trộn như được xác định dưới đây. Được ưu tiên là hỗn hợp hai thành phần gồm một hợp chất theo sáng chế làm hợp phần I với một thành phần trộn như được xác định dưới đây làm hợp phần II. Tỷ lệ trọng lượng được ưu tiên cho hỗn hợp hai thành phần này nằm trong khoảng từ 5000:1 đến 1:5000, tốt hơn là từ 1000:1 đến 1:1000, tốt hơn nữa là từ 100:1 đến 1:100, đặc biệt tốt hơn là từ 10:1 đến 1:10. Trong hỗn hợp hai thành phần này, hợp phần I và II có thể được sử dụng với lượng bằng nhau, hoặc có thể sử dụng hợp phần I với lượng dư, hoặc hợp phần II với lượng dư.

Các thành phần trộn có thể được lựa chọn từ thuốc diệt loài gây hại, cụ thể thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, và thuốc diệt ve bét, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sự phát triển của cây trồng, phân bón, và các chất tương tự. Các thành phần trộn được ưu tiên là chất diệt côn trùng, chất diệt giun tròn và chất diệt nấm.

Danh sách M sau đây về thuốc trừ sinh vật gây hại, được nhóm lại và đánh số theo phương pháp phân loại dựa trên phương thức tác động (Mode of Action Classification) của Ủy ban hành động kháng thuốc trừ côn trùng (Insecticide Resistance Action Committee - IRAC), mà các hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng cùng với chúng và có thể tạo ra tác dụng hiệp đồng tiềm năng, chỉ nhằm mục đích minh họa các dạng kết hợp có thể có mà không nhằm giới hạn theo cách bất kỳ:

M.1) Chất ức chế axetylcholin esteraza (AChE) từ nhóm gồm M.1A carbamat, ví dụ aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylylcarb và triazamat; hoặc từ nhóm gồm phosphat hữu cơ M.1B, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphosmethyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, coumaphos, xyanophos,

demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/ DDVP, dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazat, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothio-phosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos- metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon và vamidothion;

M.2. Các chất đối kháng kênh clorua qua cổng GABA như: M.2A hợp chất xyclodien clo hữu cơ, ví dụ như endosulfan hoặc chlordan; hoặc fiprol M.2B (phenylpyrazol), ví dụ như ethiprol, fipronil, flufiprol, pyrafluprol và pyriprol;

M.3 Chất điều biến kênh natri từ nhóm gồm pyrethroid M.3A, ví dụ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-xyloclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gama-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, momfloethrin, permethrin, phenothrin, prallethrin, profluthrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetrametylfluthrin, tetramethrin, tralomethrin và transfluthrin; hoặc chất điều biến kênh natri M.3B như DDT hoặc metoxychlor;

M.4 Chất chủ vận thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR) từ nhóm gồm M.4A neonicotinoid, ví dụ axetamiprid, clothianidin, xycloxaprid, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam; hoặc các hợp chất M.4A.2: (2E-)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-N'-nitro-2-pentylidenhydrazincarboximidamit; hoặc M.4A.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 nhóm M.4B nicotin;

M.5 Chất hoạt hóa thụ thể nicotinic axetylcholin dị lập thể từ nhóm gồm spinosyn, ví dụ spinosad hoặc spinetoram;

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

M.7 Chất bắt chước hormon ấu trùng, như chất tương tự hormon ấu trùng M.7A như hydroprene, kinoprene và methoprene; hoặc các chất khác như M.7B fenoxycarb hoặc M.7C pyriproxyfen;

M.8 Chất ức chế hỗn tạp không đặc hiệu (đa điểm), 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 borax, hoặc thuốc gây nôn M.8E tartar;

M.9 Chất ngăn chặn việc ăn của côn trùng cánh giống chọn lọc, ví dụ M.9B pymetrozin, hoặc M.9C flonicamid;

M.10 Chất ức chế sinh trưởng của ve bét, ví dụ M.10A clofentezin, hexythiazox và diflovidazin, hoặc M.10B etoxazol;

M.11 Các vi sinh vật phá vỡ màng ruột giữa của 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 ATP syntaza ty thể, ví dụ M.12A diafenthiuron, hoặc M.12B thuốc diệt ve bét cơ thiếc như azocyclotin, cyhexatin hoặc fenbutatin oxit, hoặc M.12C propargit, hoặc M.12D tetradifon;

M.13 Các chất cách ly phosphoryl hóa oxy hóa nhờ việc phá vỡ gradient proton, ví dụ chlorfenapyr, DNOC hoặc sulfluramid;

M.14 Chất phong bế kênh thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR), ví dụ chất tương tự nereistoxin như bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam hoặc thiosultap natri;

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

M.16 Chất ức chế quá trình sinh tổng hợp chitin kiểu 1, ví dụ như buprofezin;

M.17 Chất làm gián đoạn lột xác, đối với côn trùng hai cánh, ví dụ như cyromazine;

M.18 Chất chủ vận thụ thể ecdyson như diacylhydrazin, ví dụ metoxyfenozid, tebufenozid, halofenozid, fufenozid hoặc chromafenozid;

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

M.20 Chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể, ví dụ M.20A hydrametylnon, hoặc M.20B acequinocyl, hoặc M.20C fluacrypyrim;

M.21 Chất ức chế vận chuyển điện tử phức I ty thể, ví dụ chất diệt be vết M.21A METI và chất diệt côn trùng như fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad hoặc tolfenpyrad, hoặc M.21B rotenon;

M.22 Chất chặn kênh natri phụ thuộc điện thế, 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]-hydrazincaboxamit hoặc M.22B.2: N-(3-clo-2-metylphenyl)-2-[(4-clophenyl)[4-[metyl(metylsulfonyl)amino]phenyl]metylen]-hydrazincaboxamit;

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 điện tử phức IV ty thể, 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 điện tử phức II ty thể, như dẫn xuất beta-ketonitril, ví dụ xyenopyrafen hoặc cyflumetofen;

M.28 Chất điều biến thụ thể ryanodin từ nhóm gồm diamit, ví dụ như flubendiamit, chlorantraniliprol (rynaxypyr®), xyantraniliprol (cyazypyr®), tetraniliprol hoặc hợp chất phtalamit M.28.1: (R)-3-clo-N1-{2-metyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(trifluormetyl)etyl]phenyl}-N2-(1-metyl-2-metylsulfonyletyl)phthalamid và M.28.2: (S)-3-clo-N1-{2-metyl-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(trifluormetyl)etyl]phenyl}-N2-(1-metyl-2-

methylsulfonyl)phthalamid, hoặc hợp chất M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)carbamoyletyl]phenyl}-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (tên được đề xuất theo ISO: xydaniliprol), hoặc hợp chất M.28.4: methyl-2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-clopyridin-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl]carbonyl}amino)benzoyl]-1,2-dimethylhydrazincarboxylat; hoặc hợp chất được chọn từ M.28.5a) đến M.28.5d) và M.28.5h) đến M.28.5l): M.28.5a) N-[4,6-diclo-2-[(diethyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyletyl]phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-carboxamit; M.28.5b) N-[4-clo-2-[(diethyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyletyl]-6-methylphenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-carboxamit; M.28.5c) N-[4-clo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyletyl]-6-methylphenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-carboxamit; M.28.5d) N-[4,6-diclo-2-[(di-2-propyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyletyl]phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-carboxamit; M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(diethyl-lambda-4-sulfanyliden)carbamoyletyl]phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)-5-(triflometyl)pyrazol-3-carboxamit; M.28.5i) N-[2-(5-Amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-methylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit; M.28.5j) 3-clo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-N-[2,4-diclo-6-[(1-xyano-1-metyletyl)amino]carbonyl]phenyl]-1H-pyrazol-5-carboxamit; M.28.5k) 3-Bromo-N-[2,4-diclo-6-(methylcarbamoyletyl)phenyl]-1-(3,5-diclo-2-pyridyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit; M.28.5l) N-[4-clo-2-[(1,1-dimetyletyl)amino]carbonyl]-6-methylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-carboxamit; hoặc

M.28.6: xyhalodiamit; hoặc;

M.29. Các hợp chất có hoạt tính trừ sâu có phương thức tác động chưa biết hoặc không xác định, ví dụ như afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, amidoflomet, benzoximat, bifenazat, broflanilid, bromopropylat, chinomethionat, cryolit, diclomezotiaz, dicofol, flufenerim, flometoquin, fluensulfon, fluhexafon, fluopyram, flupyradifuron, fluralaner, metoxadiazon, piperonyl butoxit, pyflubumit, pyridalyl, pyrifluquinazon, sulfoxaflo, tioxazafen, triflumezopyrim, hoặc các hợp chất

M.29.3: 11-(4-clo-2,6-dimethylphenyl)-12-hydroxy-1,4-dioxa-9-azadispiro[4,2,4,2]-tetradec-11-en-10-on, hoặc hợp chất

M.29.4: 3-(4'-flo-2,4-dimethylbiphenyl-3-yl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-on, hoặc hợp chất

M.29.5: 1-[2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl]-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin, hoặc hoạt tính trên cơ sở *bacillus firmus* (Votivo, I-1582); hoặc

hợp chất được chọn từ nhóm gồm M.29.6, trong đó hợp chất này được chọn từ M.29.6a) đến M.29.6k): M.29.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit; M.29.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-5-flo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit; M.29.6c) (E/Z)-2,2,2-triflo-N-[1-[(6-flo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]axetamit; M.29.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit; M.29.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-clo-3-pyridyl)etyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit; M.29.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2-diflo-axetamit; M.29.6g) (E/Z)-2-clo-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2-diflo-axetamit; M.29.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-clopyrimidin-5-yl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-axetamit; M.29.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,3,3,3-pentafloropropanamit); M.29.6j) N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-thioaxetamit; hoặc M.29.6k) N-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-2,2,2-triflo-N'-isopropyl-axetamidin; hoặc các hợp chất M.29.8:

M.29.8: fluazaindolizine; hoặc hợp chất

M.29.9.a): 4-[5-(3,5-diclophenyl)-5-(triflometyl)-4H-isoxazol-3-yl]-2-metyl-N-(1-oxothietan-3-yl)benzamit; hoặc M.29.9.b): fluxametamit; hoặc

M.29.10: 5-[3-[2,6-diclo-4-(3,3-dicloalxyloxy)phenoxy]propoxy]-1H-pyrazol; hoặc hợp chất được chọn từ nhóm gồm M.29.11, trong đó hợp chất này được chọn từ M.29.11b) đến M.29.11p): M.29.11.b) 3-(benzoylmetylamin)-N-[2-bromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexaflo-1-(triflometyl)propyl]-6-(triflometyl)phenyl]-2-flo-benzamit; M.29.11.c) 3-(benzoylmetylamin)-2-flo-N-[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]-benzamit; M.29.11.d) N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]carbonyl]phenyl]-N-metylbenzamit; M.29.11.e) N-[3-[[[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]carbonyl]-2-flophenyl]-4-flo-N-metylbenzamit; M.29.11.f) 4-

flo-N-[2-flo-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]carbonyl]phenyl]-N-metyl-benzamit; M.29.11.g) 3-flo-N-[2-flo-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]carbonyl]phenyl]-N-metyl-benzamit; M.29.11.h) 2-clo-N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetraflo-1-(triflometyl)etyl]-6-(triflometyl)phenyl]amino]carbonyl]phenyl]-3-pyridinecarboxamit; M.29.11.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.29.11.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.29.11.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.29.11.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.29.11.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.29.11.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.29.11.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.29.11.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;

hợp chất được chọn từ nhóm gồm M.29.12, trong đó hợp chất này được chọn từ M.29.12a) đến M.29.12m): M.29.12.a) 2-(1,3-Dioxan-2-yl)-6-[2-(3-pyridinyl)-5-thiazolyl]-pyridin; M.29.12.b) 2-[6-[2-(5-flo-3-pyridinyl)-5-thiazolyl]-2-pyridinyl]-pyrimidin; M.29.12.c) 2-[6-[2-(3-Pyridinyl)-5-thiazolyl]-2-pyridinyl]-pyrimidin; M.29.12.d) N-metylsulfonyl-6-[2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]pyridin-2-carboxamit; M.29.12.e) N-metylsulfonyl-6-[2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]pyridin-2-carboxamit; M.29.12.f) N-etyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit; M.29.12.g) N-metyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit; M.29.12.h) N,2-Dimetyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit;

M.29.12.i) N-etyl-2-metyl-N-[4-metyl-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-3-metylthio-propanamit;
 M.29.12.j) N-[4-clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-etyl-2-metyl-3-metylthio-propanamit;
 M.29.12.k) N-[4-clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N,2-dimetyl-3-metylthio-propanamit;
 M.29.12.l) N-[4-clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-metyl-3-metylthio-propanamit;
 M.29.12.m) N-[4-clo-2-(3-pyridyl)thiazol-5-yl]-N-etyl-3-metylthio-propanamit; hoặc hợp chất

M.29.14a) 1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-1,2,3,5,6,7-hexahydro-5-metoxi-7-metyl-8-nitro-imidazo[1,2-a]pyridin; hoặc M.29.14b) 1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]-7-metyl-8-nitro-1,2,3,5,6,7-hexahydroimidazo[1,2-a]pyridin-5-ol; hoặc các hợp chất

M.29.16a) 1-isopropyl-N,5-dimetyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; hoặc M.29.16b) 1-(1,2-dimetylpropyl)-N-etyl-5-metyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16c) N,5-dimetyl-N-pyridazin-4-yl-1-(2,2,2-triflo-1-metyl-etyl)pyrazol-4-carboxamit; M.29.16d) 1-[1-(1-xyanoxyclopropyl)etyl]-N-etyl-5-metyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16e) N-etyl-1-(2-flo-1-metyl-propyl)-5-metyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16f) 1-(1,2-dimetylpropyl)-N,5-dimetyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16g) 1-[1-(1-xyanoxyclopropyl)etyl]-N,5-dimetyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16h) N-metyl-1-(2-flo-1-metyl-propyl)-5-metyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; M.29.16i) 1-(4,4-difloxylohexyl)-N-etyl-5-metyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit; hoặc M.29.16j) 1-(4,4-difloxylohexyl)-N,5-dimetyl-N-pyridazin-4-yl-pyrazol-4-carboxamit, hoặc

M.29.17 các hợp chất được chọn từ các hợp chất M.29.17a) đến M.29.17j):
 M.29.17a) N-(1-metyletyl)-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-4-carboxamit; M.29.17b) N-xyclopropyl-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-4-carboxamit; M.29.17c) N-xyclohexyl-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-4-carboxamit; M.29.17d) 2-(3-pyridinyl)-N-(2,2,2-trifloetyl)-2H-indazol-4-carboxamit; M.29.17e) 2-(3-pyridinyl)-N-[(tetrahydro-2-furanyl)metyl]-2H-indazol-5-carboxamit; M.29.17f) metyl 2-[[2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-yl]carbonyl]hydrazincarboxylat; M.29.17g) N-[(2,2-difloxylopropyl)metyl]-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-carboxamit; M.29.17h) N-(2,2-diflopropyl)-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-carboxamit; M.29.17i) 2-(3-pyridinyl)-N-(2-pyrimidinylmetyl)-2H-indazol-5-

carboxamit; M.29.17j) N-[(5-metyl-2-pyrazinyl)metyl]-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-carboxamit, hoặc

M.29.18 các hợp chất được chọn từ các hợp chất M.29.18a) đến M.29.18d):
 M.29.18a) N-[3-clo-1-(3-pyridyl)pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-(3,3,3-triflopropylsulfanyl)propanamit; M.29.18b) N-[3-clo-1-(3-pyridyl)pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-(3,3,3-triflopropylsulfanyl)propanamit; M.29.18c) N-[3-clo-1-(3-pyridyl)pyrazol-4-yl]-3-[(2,2-difloxypropyl)metylsulfanyl]-N-etyl-propanamit; M.29.18d) N-[3-clo-1-(3-pyridyl)pyrazol-4-yl]-3-[(2,2-difloxypropyl)metylsulfanyl]-N-etyl-propanamit; hoặc hợp chất

M.29.19 sarolaner, hoặc hợp chất

M.29.20 lotilaner.

Các hợp chất sẵn có để bán thuộc nhóm M được liệt kê trên đây có thể được tìm thấy trong The Pesticide Manual, 16th Edition, C. MacBean, British Crop Protection Council (2013) không kể những công bố khác. Sổ tay chất diệt sinh vật gây hại trực tuyến được cập nhật thường xuyên và có thể truy cập qua <http://bcpdata.com/pesticide-manual.html>.

Cơ sở dữ liệu trực tuyến khác đối với thuốc trừ dịch hại với tên gọi thông thường theo ISO là <http://www.alanwood.net/pesticides>.

M.4 neonicotinoid cycloxaprid là đã biết từ WO2010/069266 và WO2011/069456, neonicotinoid M.4A.2, đôi khi còn được gọi là guadipyr, là đã biết từ WO2013/003977, và neonicotinoid M.4A.3 (được phê chuẩn là paichongding ở Trung Quốc) là đã biết từ WO2007/101369. Chất tương tự metaflumizon M.22B.1 được mô tả trong CN10171577 và chất tương tự M.22B.2 trong CN102126994. Phthalamit M.28.1 và M.28.2 đều đã biết từ WO2007/101540. Anthranilamit M.28.3 được mô tả trong WO2005/077934. Hợp chất hydrazit M.28.4 được mô tả trong WO2007/043677. Anthranilamit M.28.5a) đến M.28.5d) và M.28.5h) được mô tả trong WO 2007/006670, WO2013/024009 và WO2013/024010, anthranilamit M.28.5i) được mô tả trong WO2011/085575, M.28.5j) trong WO2008/134969, M.28.5k) trong US2011/046186 và M.28.5l) trong WO2012/034403. Hợp chất diamit M.28.6 có thể được tìm thấy trong WO2012/034472. Dẫn xuất ketoenol

mạch vòng được thể spiroketal M.29.3 là đã biết từ WO2006/089633 và dẫn xuất ketoenol vòng spiro được thể biphenyl M.29.4 từ WO2008/067911. Triazolylphenylsulfua M.29.5 được mô tả trong WO2006/043635, và các tác nhân phòng trừ sinh học trên cơ sở *bacillus firmus* được mô tả trong WO2009/124707. Hợp chất M.29.6a) đến M.29.6i) được liệt kê trong M.29.6 được mô tả trong WO2012/029672, và M.29.6j) và M.29.6k) trong WO2013/129688. Thuốc diệt giun tròn M.29.8 là đã biết từ WO2013/055584. Isoxazolin M.29.9.a) được mô tả trong WO2013/050317. Isoxazolin M.29.9.b) được mô tả trong WO2014/126208. Chất tương tự kiểu pyridalyl M.29.10 là đã biết từ WO2010/060379. Carboxamit broflanilid và M.29.11.b) đến M.29.11.h) được mô tả trong WO2010/018714, và carboxamit M.29.11.i) đến M.29.11.p) trong WO2010/127926. Pyridylthiazol M.29.12.a) đến M.29.12.c) là đã biết từ WO2010/006713, M.29.12.d) và M.29.12.e) là đã biết từ WO2012/000896, và M.29.12.f) đến M.29.12.m) từ WO2010/129497. Hợp chất M.29.14a) và M.29.14b) là đã biết từ WO2007/101369. Pyrazol M.29.16.a) đến M.29.16h) được mô tả trong WO2010/034737, WO2012/084670, và WO2012/143317, tương ứng, và pyrazol M.29.16i) và M.29.16j) được mô tả trong US 61/891437. Pyridinylindazol M.29.17a) đến M.29.17.j) được mô tả trong WO2015/038503. Pyridylpyrazol M.29.18a) đến M.29.18d) được mô tả trong US2014/0213448. Isoxazolin M.29.19 được mô tả trong WO2014/036056. Isoxazolin M.29.20 là đã biết từ WO2014/090918.

Danh sách các thuốc diệt nấm sau đây, mà hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng phối hợp với nó, chỉ nhằm minh họa các chế phẩm kết hợp có thể có mà không nhằm giới hạn chúng:

- A) Chất ức chế hô hấp
 - Các chất ức chế phức hợp III tại vị trí Q_o (ví dụ, strobilurin): azoxystrobin (A.1.1), coumetoxystrobin (A.1.2), coumoxystrobin (A.1.3), dimoxystrobin (A.1.4), enestroburin (A.1.5), fenaminstrobin (A.1.6), fenoxystrobin/flufenoxystrobin (A.1.7), fluoxastrobin (A.1.8), kresoxim-metyl (A.1.9), mandestrobin (A.1.10), metominostrobin (A.1.11), orysastrobin (A.1.12), picoxy.strobin (A.1.13), pyraclostrobin (A.1.14), pyrametostrobin (A.1.15), pyraoxystrobin (A.1.16), trifloxystrobin (A.1.17), 2-(2-(3-(2,6-diclophenyl)-1-metyl-alyldenaminooxymetyl)-phenyl)-2-metoxylimino-N-metyl-axetamit

(A.1.18), pyribencarb (A.1.19), triclopyricarb/clodincarb (A.1.20), famoxadon (A.1.21), fenamidon (A.1.21), methyl-*N*-[2-[(1,4-dimethyl-5-phenyl-pyrazol-3-yl)oxymethyl]phenyl]-*N*-methoxy-carbamate (A.1.22), 1-[3-clo-2-[[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl]phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.23), 1-[3-bromo-2-[[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxymethyl]phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.24), 1-[2-[[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxymethyl]-3-methyl-phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.25), 1-[2-[[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxymethyl]-3-flo-phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.26), 1-[2-[[1-(2,4-diclophenyl)pyrazol-3-yl]oxymethyl]-3-flo-phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.27), 1-[2-[[4-(4-clophenyl)thiazol-2-yl]oxymethyl]-3-methyl-phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.28), 1-[3-clo-2-[[4-(p-tolyl)thiazol-2-yl]oxymethyl]phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.29), 1-[3-xyclopropyl-2-[[2-methyl-4-(1-methylpyrazol-3-yl)phenoxy]methyl]phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.30), 1-[3-(diflometoxy)-2-[[2-methyl-4-(1-methylpyrazol-3-yl)phenoxy]methyl]phenyl]-4-methyl-tetrazol-5-on (A.1.31), 1-methyl-4-[3-methyl-2-[[2-methyl-4-(1-methylpyrazol-3-yl)phenoxy]methyl]phenyl]tetrazol-5-on (A.1.32), 1-methyl-4-[3-methyl-2-[[1-[3-(triflometyl)phenyl]ethylidenamino]oxymethyl]phenyl]tetrazol-5-on (A.1.33), (*Z,2E*)-5-[1-(2,4-diclophenyl)pyrazol-3-yl]-oxy-2-metoxymino-*N*,3-dimethyl-pent-3-enamit (A.1.34), (*Z,2E*)-5-[1-(4-clophenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxymino-*N*,3-dimethyl-pent-3-enamit (A.1.35), (*Z,2E*)-5-[1-(4-clo-2-flo-phenyl)pyrazol-3-yl]oxy-2-metoxymino-*N*,3-dimethyl-pent-3-enamit (A.1.36),

- các chất ức chế phức III ở vị trí Q_i: cyazofamid (A.2.1), amisulbrom (A.2.2), [(3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-8-benzyl-3-[(3-axetoxo-4-metoxo-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat (A.2.3), [(3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-8-benzyl-3-[[3-(axetoxymetoxo)-4-metoxo-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat (A.2.4), [(3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-8-benzyl-3-[(3-isobutoxycarbonyloxy-4-metoxo-pyridin-2-carbonyl)amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat (A.2.5), [(3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-8-benzyl-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ylmetoxo)-4-metoxo-pyridin-2-carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl] 2-methylpropanoat (A.2.6); (3*S*,6*S*,7*R*,8*R*)-3-[[3-(hydroxy-4-metoxo-2-

pyridinyl)carbonyl]amino]-6-metyl-4,9-dioxo-8-(phenylmetyl)-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat (A.2.7), (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[3-[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypicolinamido]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl isobutyrat (A.2.8);

- các chất ức chế phức II (ví dụ, các carboxamit): benodanil (A.3.1), benzovindiflupyr (A.3.2), bixafen (A.3.3), boscalid (A.3.4), carboxin (A.3.5), fenfuram (A.3.6), fluopyram (A.3.7), flutolanil (A.3.8), fluxapyroxad (A.3.9), furametpyr (A.3.10), isofetamid (A.3.11), isopyrazam (A.3.12), mepronil (A.3.13), oxycarboxin (A.3.14), penflufen (A.3.14), penthiopyrad (A.3.15), sedaxan (A.3.16), tecloftalam (A.3.17), thifluzamid (A.3.18), N-(4'-triflometylthiobiphenyl-2-yl)-3-diflometyl-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit (A.3.19), N-(2-(1,3,3-trimetyl-butyl)-phenyl)-1,3-dimetyl-5-flo-1H-pyrazol-4-carboxamit (A.3.20), 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit (A.3.21), 3-(triflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit (A.3.22), 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit (A.3.23), 3-(triflometyl)-1,5-dimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit (A.3.24), 1,3,5-trimetyl-N-(1,1,3-trimetylinđan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit (A.3.25), N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-đan-4-yl)-1,3-dimetyl-pyrazol-4-carboxamit (A.3.26), N-[2-(2,4-diclophenyl)-2-metoxi-1-metyl-etyl]-3-(diflometyl)-1-metyl-pyrazol-4-carboxamit (A.3.27);

- các chất ức chế hô hấp khác (ví dụ, phức hợp I, chất cách ly): diflumentorim (A.4.1), (5,8-difloquinazolin-4-yl)-{2-[2-flo-4-(4-triflometylpyridin-2-yloxy)-phenyl]-etyl}-amin (A.4.2); các dẫn xuất nitrophenyl: binapacryl (A.4.3), dinobuton (A.4.4), dinocap (A.4.5), fluazinam (A.4.6); ferimzon (A.4.7); các hợp chất cơ kim: các muối fentin, như fentin-axetat (A.4.8), fentin clorua (A.4.9) hoặc fentin hydroxit (A.4.10); ametoctradin (A.4.11); và silthiofam (A.4.12);

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

- các chất ức chế C14 demetylaza (thuốc diệt nấm DMI): các triazol: azaconazol (B.1.1), bitertanol (B.1.2), bromuconazol (B.1.3), cyproconazol (B.1.4), difenoconazol (B.1.5), diniconazol (B.1.6), diniconazol-M (B.1.7), epoxiconazol (B.1.8), fenbuconazol (B.1.9), fluquinconazol (B.1.10), flusilazol (B.1.11), flutriafol (B.1.12),

hexaconazol (B.1.13), imibenconazol (B.1.14), ipconazol (B.1.15), metconazol (B.1.17), myclobutanil (B.1.18), oxpoconazol (B.1.19), paclobutrazol (B.1.20), penconazol (B.1.21), propiconazol (B.1.22), prothioconazol (B.1.23), simeconazol (B.1.24), tebuconazol (B.1.25), tetraconazol (B.1.26), triadimefon (B.1.27), triadimenol (B.1.28), triticonazol (B.1.29), uniconazol (B.1.30), 1-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-5-thioxyanato-1H-[1,2,4]triazolo (B.1.31), 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)-oxiranylmetyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-thiol (B.1.32), 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol (B.1.33), 1-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-xyclopropyl-2-(1,2,4-triazol-1-yl)etanol (B.1.34), 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (B.1.35), 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (B.1.36), 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-3-metyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (B.1.37), 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol (B.1.38), 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-3-metyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (B.1.39), 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol (B.1.40), 2-[4-(4-flophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol (B.1.41), 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1,2,4-triazol-1-yl)pent-3-yn-2-ol (B.1.51); các imidazol: imazalil (B.1.42), pefurazoat (B.1.43), prochloraz (B.1.44), triflumizol (B.1.45); các pyrimidin, các pyridin và các piperazin: fenarimol (B.1.46), nuarimol (B.1.47), pyrifenox (B.1.48), triformin (B.1.49), [3-(4-clo-2-flo-phenyl)-5-(2,4-diflophenyl)isoxazol-4-yl]-(3-pyridyl)metanol (B.1.50);

- chất ức chế delta14-reductaza: aldimorph (B.2.1), dodemorph (B.2.2), dodemorph-axetat (B.2.3), fenpropimorph (B.2.4), tridemorph (B.2.5), fenpropidin (B.2.6), piperalin (B.2.7), spiroxamin (B.2.8);

- chất ức chế 3-keto reductaza: fenhexamid (B.3.1);

C) Chất ức chế quá trình tổng hợp axit nucleic

- phenylamit hoặc thuốc diệt nấm axit amin axyl: benalaxyl (C.1.1), benalaxyl-M (C.1.2), kiralaxyl (C.1.3), metalaxyl (C.1.4), metalaxyl-M (mefenoxam, C.1.5), ofurace (C.1.6), oxadixyl (C.1.7);

- các chất khác: hymexazol (C.2.1), oethilidon (C.2.2), axit oxolinic (C.2.3), bupirimat (C.2.4), 5-floctosin (C.2.5), 5-flo-2-(p-tolylmetoxy)pyrimidin-4-amin (C.2.6), 5-flo-2-(4-flophenylmetoxy)pyrimidin-4-amin (C.2.7);

D) chất ức chế sự phân bào và khung tế bào

- chất ức chế tubulin, như benzimidazol, thiophanat: benomyl (D1.1), carbendazim (D1.2), fuberidazol (D1.3), thiabendazol (D1.4), thiophanat-metyl (D1.5); triazolopyrimidin: 5-clo-7-(4-metylpipeidin-1-yl)-6-(2,4,6-triflophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin (D1.6);

- chất ức chế phân bào khác: diethofencarb (D2.1), ethaboxam (D2.2), pencycuron (D2.3), fluopicolide (D2.4), zoxamit (D2.5), metrafenon (D2.6), pyriofenon (D2.7);

E) Các chất ức chế quá trình tổng hợp axit amin và protein

- chất ức chế tổng hợp methionin (anilino-pyrimidin): cyprodinil (E.1.1), mepanipyrim (E.1.2), pyrimethanil (E.1.3);

- chất ức chế tổng hợp protein: blasticidin-S (E.2.1), kasugamycin (E.2.2), kasugamycin hydroclorua-hydrat (E.2.3), mildiomydin (E.2.4), streptomycin (E.2.5), oxytetracyclin (E.2.6), polyoxine (E.2.7), validamycin A (E.2.8);

F) Chất ức chế dẫn truyền tín hiệu

- chất ức chế MAP / histidin kinaza: floimid (F.1.1), iprodion (F.1.2), procymidon (F.1.3), vinclozolin (F.1.4), fenpiclonil (F.1.5), fludioxonil (F.1.6);

- chất ức chế protein G: quinoxifen (F.2.1);

G) Chất ức chế quá trình tổng hợp lipid và màng

- Chất ức chế sinh tổng hợp phospholipit: edifenphos (G.1.1), iprobenfos (G.1.2), pyrazophos (G.1.3), isoprothiolan (G.1.4);

- peroxy hoá lipid: dicloran (G.2.1), quitozen (G.2.2), tecnazen (G.2.3), tolclofos-metyl (G.2.4), biphenyl (G.2.5), chloroneb (G.2.6), etridiazol (G.2.7);

- chất lắng đọng thành tế bào và sinh tổng hợp phospholipit: dimethomorph (G.3.1), flumorph (G.3.2), mandipropamid (G.3.3), pyrimorph (G.3.4), benthiavalicarb (G.3.5), iprovalicarb (G.3.6), valifenalat (G.3.7) và (4-flophenyl) este của axit N-(1-(1-(4-

xyano-phenyl)etansulfonyl)-but-2-yl) carbamic (G.3.8);

- hợp chất tác động đến tính thấm màng tế bào và axit béo: propamocarb (G.4.1);

- chất ức chế enzym hydrolaza của amit của axit béo: oxathiapirolin (G.5.1), 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenyl metansulfonat (G.5.2), 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl) 1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat (G.5.3);

H) chất ức chế với đa vị trí tác động

- hoạt chất vô cơ: Hỗn hợp Bordeaux (H.1.1), đồng axetat (H.1.2), đồng hydroxit (H.1.3), đồng oxyclorea (H.1.4), đồng sulfat bazơ (H.1.5), lưu huỳnh (H.1.6);

- thio- và dithiocarbamat: ferbam (H.2.1), mancozeb (H.2.2), maneb (H.2.3), metam (H.2.4), metiram (H.2.5), propineb (H.2.6), thiram (H.2.7), zineb (H.2.8), ziram (H.2.9);

- các hợp chất clo hữu cơ (chẳng hạn phtalimit, sulfamit, clonitril): anilazin (H.3.1), clothalonil (H.3.2), captafol (H.3.3), captan (H.3.4), folpet (H.3.5), dichlofluanid (H.3.6), diclophen (H.3.7), hexaclobenzen (H.3.8), pentaclophenol (H.3.9) và các muối của nó, phthalid (H.3.10), tolylfluanid (H.3.11), N-(4-clo-2-nitro-phenyl)-N-etyl-4-metyl-benzensulfonamit (H.3.12);

- guanidin và các chất khác: guanidin (H.4.1), dodin (H.4.2), bazơ không chứa dodin (H.4.3), guazatin (H.4.4), guazatin-axetat (H.4.5), iminoctadin (H.4.6), iminoctadin-triaxetat (H.4.7), iminoctadin-tris(albesilat) (H.4.8), dithianon (H.4.9), 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraon (H.4.10);

I) Chất ức chế tổng hợp thành tế bào

- chất ức chế tổng hợp glucan: validamycin (I.1.1), polyoxin B (I.1.2);

Chất ức chế tổng hợp melanin: pyroquilon (I.2.1), tricyclazole (I.2.2), carpropamid (I.2.3), dixyclomet (I.2.4), fenoxanil (I.2.5).

J) Các chất gây ra sự phòng vệ thực vật

- acibenzolar-S-metyl (J.1.1), probenazole (J.1.2), isotianil (J.1.3), tiadinil

(J.1.4), prohexadion-canxi (J.1.5); phosphonat: fosetyl (J.1.6), fosetyl-nhôm (J.1.7), axit phosphorơ và các muối của nó (J.1.8), kali hoặc natri bicacbonat (J.1.9);

K) Phương thức tác động chưa biết

- bronopol (K.1.1), chinomethionat (K.1.2), cyflufenamid (K.1.3), cymoxanil (K.1.4), dazomet (K.1.5), debacarb (K.1.6), diclomezin (K.1.7), difenzoquat (K.1.8), difenzoquat-metylsulfat (K.1.9), diphenylamin (K.1.10), fenpyrazamin (K.1.11), flumetover (K.1.12), flusulfamid (K.1.13), flutianil (K.1.14), methasulfocarb (K.1.15), nitrapyrin (K.1.16), nitrothal-isopropyl (K.1.18), oxathiapiprolin (K.1.19), tolprocarb (K.1.20), oxin-đồng (K.1.21), proquinazid (K.1.22), tebufloquin (K.1.23), tecloftalam (K.1.24), triazoxid (K.1.25), 2-butoxy-6-iodo-3-propylchromen-4-on (K.1.26), 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon (K.1.27), 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon (K.1.28), 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon (K.1.29), N-(xyclopropylmetoxyimino-(6-diflo-metoxi-2,3-diflo-phenyl)-metyl)-2-phenyl axetamit (K.1.30), N'-(4-(4-clo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin (K.1.31), N'-(4-(4-flo-3-triflometyl-phenoxy)-2,5-dimetyl-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin (K.1.32), N'-(2-metyl-5-triflometyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin (K.1.33), N'-(5-diflometyl-2-metyl-4-(3-trimetylsilanyl-propoxy)-phenyl)-N-etyl-N-metyl formamidin (K.1.34), 6-tert-butyl-8-flo-2,3-dimetyl-quinolin-4-yl este của axit metoxy-axetic (K.1.35), 3-[5-(4-metylphenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin (K.1.36), 3-[5-(4-clo-phenyl)-2,3-dimetyl-isoxazolidin-3-yl]-pyridin (pyrisoxazol) (K.1.37), axit N-(6-metoxi-pyridin-3-yl) xyclopropanocarboxylic amit (K.1.38), 5-clo-1-(4,6-dimetoxi-pyrimidin-2-yl)-2-metyl-1H-benzoimidazol (K.1.39), 2-(4-clo-phenyl)-N-[4-(3,4-dimetoxi-phenyl)-isoxazol-5-yl]-2-prop-2-ynyloxy-axetamit, etyl (Z)-3-amino-2-xyano-3-phenyl-prop-2-enoat (K.1.40), picarbutrazox (K.1.41), pentyl N-[6-[(Z)-[(1-metyltetrazol-5-yl)-phenyl-metylen]amino]oxymetyl]-2-pyridyl]carbamit (K.1.42), 2-[2-

[(7,8-diflo-2-metyl-3-quinolyl)oxy]-6-flo-phenyl]propan-2-ol (K.1.43), 2-[2-flo-6-[(8-flo-2-metyl-3-quinolyl)oxy]phen-yl]propan-2-ol (K.1.44), 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin (K.1.45), 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin (K.1.46), 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin (K.1.47), 9-flo-2,2-dimetyl-5-(3-quinolyl)-3H-1,4-benzoxazepin (K.1.48).

Thuốc diệt nấm được mô tả bởi những tên gọi thông thường, việc điều chế chúng và hoạt tính của chúng chẳng hạn chống lại nấm gây hại là đã được biết đến (tham khảo: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); các chất này là có sẵn trên thị trường.

Các thuốc diệt nấm này được mô tả bởi danh pháp IUPAC, việc điều chế chúng và hoạt tính diệt sinh vật gây hại của chúng cũng đã được biết (xem Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP-A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP-A 243 970; EP-A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP-A 1 201 648; EP-A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657, WO2012/168188, WO 2007/006670, WO 2011/77514; WO13/047749, WO 10/069882, WO 13/047441, WO 03/16303, WO 09/90181, WO 13/007767, WO 13/010862, WO 13/127704, WO 13/024009, WO 13/024010 và WO 13/047441, WO 13/162072, WO 13/092224, WO 11/135833).

Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại

Các thành phần trộn thích hợp cho hợp chất theo sáng chế còn bao gồm các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại.

Tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại đã được xác định dưới dạng thuốc diệt sinh

vật gây hại dựa trên các vi sinh vật (vi khuẩn, nấm, virus, giun tròn, v.v.) hoặc các sản phẩm tự nhiên (các hợp chất, như các chất chuyển hóa, các protein, hoặc các chất chiết từ các nguồn sinh học hoặc tự nhiên khác) (U.S. Environmental Protection Agency: <http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>). Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại thuộc hai nhóm chính, thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh và thuốc diệt sinh vật gây hại sinh hóa:

(1) Thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh chứa vi khuẩn, nấm hoặc virus (và thường gồm các chất chuyển hóa mà vi khuẩn và nấm sản xuất). Tuyến trùng ký sinh và gây bệnh cho côn trùng (Entomopathogenic nematodes) còn được phân nhóm thành các thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh, mặc dù chúng là sinh vật đa bào.

(2) Thuốc diệt sinh vật gây hại hoá sinh là các chất có trong tự nhiên hoặc hợp chất và chiết xuất giống về mặt chức năng và tương tự về mặt cấu trúc với các chất có trong tự nhiên từ các nguồn sinh học có khả năng phòng trừ sinh vật gây hại hoặc tạo ra các ứng dụng bảo vệ cây trồng khác như được xác định dưới đây, nhưng có kiểu tác động không độc (như điều hoà sinh trưởng hoặc phát triển, chất dẫn dụ, chất hoạt hoá xua đuổi hoặc bảo vệ (ví dụ, tạo tính kháng) và tương đối không độc với động vật có vú.

Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại dùng để chống lại các bệnh của cây trồng đã được tự thiết lập trên các loại cây trồng. Ví dụ, các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại đã có vai trò quan trọng trong việc phòng trừ bệnh nấm mốc trắng. Các lợi ích của chúng bao gồm: khoảng thời gian tiền thu hoạch vào ngày 0, khả năng sử dụng dưới áp lực bệnh từ vừa phải đến nghiêm trọng, và khả năng sử dụng trong hỗn hợp hoặc trong chương trình luân chuyển với các thuốc diệt sinh vật gây hại đã đăng ký khác.

Lĩnh vực phát triển mạnh các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại là lĩnh vực xử lý hạt và cải tạo đất. Việc xử lý hạt bằng các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại là ví dụ, sử dụng để phòng trừ mầm bệnh nấm trong đất mà gây ra các bệnh thối hạt, úng nước, thối rễ và hụi cây giống. Chúng cũng có thể được sử dụng để phòng trừ mầm bệnh nấm trong đất cũng như mầm bệnh nấm nằm trên bề mặt hạt. Nhiều sản phẩm sinh học diệt sinh vật gây hại còn thể hiện khả năng kích thích sự bảo vệ thực vật chủ và các quy trình sinh lý khác mà có thể làm cho thực vật đã được xử lý có khả năng chống chịu cao hơn với các

ứng suất sinh vật và phi sinh vật hoặc có thể điều hoà sự sinh trưởng của thực vật. Nhiều sản phẩm sinh học diệt sinh vật gây hại còn thể hiện khả năng kích thích sức khoẻ cho thực vật, sự sinh trưởng của thực vật và/hoặc hoạt tính làm tăng hiệu suất.

Danh sách các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại sau đây, mà hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng phối hợp với nó, chỉ nhằm minh họa các các chế phẩm kết hợp có thể có mà không nhằm giới hạn chúng:

L) Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại

L1) Các thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh với hoạt tính diệt nấm, diệt khuẩn, diệt virus và/hoặc hoạt tính kích hoạt khả năng phòng vệ của thực vật: *Ampelomyces quisqualis*, *Aspergillus flavus*, *Aureobasidium pullulans*, *Bacillus altitudinis*, *B. amyloliquefaciens*, *B. megaterium*, *B. mojavensis*, *B. mycoides*, *B. pumilus*, *B. simplex*, *B. solisalsi*, *B. subtilis*, *B. subtilis* var. *amyloliquefaciens*, *Candida oleophila*, *C. saitoana*, *Clavibacter michiganensis* (thể thực khuẩn), *Coniothyrium minitans*, *Cryphonectria parasitica*, *Cryptococcus albidus*, *Dilophosphora alopecuri*, *Fusarium oxysporum*, *Clonostachys rosea* f. *catenulate* (also named *Gliocladium catenulatum*), *Gliocladium roseum*, *Lysobacter antibioticus*, *L. enzymogenes*, *Metschnikowia fructicola*, *Microdochium dimerum*, *Microsphaeropsis ochracea*, *Muscodor albus*, *Paenibacillus alvei*, *Paenibacillus polymyxa*, *Pantoea vagans*, *Penicillium bilaiae*, *Phlebiopsis gigantea*, *Pseudomonas* sp., *Pseudomonas chloraphis*, *Pseudozyma flocculosa*, *Pichia anomala*, *Pythium oligandrum*, *Sphaerodes mycoparasitica*, *Streptomyces griseoviridis*, *S. lydicus*, *S. violaceusniger*, *Talaromyces flavus*, *Trichoderma asperelloides*, *T. asperellum*, *T. atroviride*, *T. fertile*, *T. gamsii*, *T. harmatum*, *T. harzianum*, *T. polysporum*, *T. stromaticum*, *T. virens*, *T. viride*, *Typhula phacorrhiza*, *Ulocladium oudemansii*, *Verticillium dahlia*, virus khảm vàng hại bầu bí (chủng giảm độc lực);

L2) Thuốc diệt sinh vật gây hại sinh hóa có hoạt tính diệt nấm, diệt khuẩn, diệt virus và/hoặc kích hoạt khả năng phòng vệ của thực vật: protein harpin, chiết xuất *Reynoutria sachalinensis*;

L3) Thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh có hoạt tính diệt côn trùng, diệt ve bét, diệt nhuyễn thể và/hoặc diệt giun tròn: *Agrobacterium radiobacter*, *Bacillus*

cereus, *B. firmus*, *B. thuringiensis*, *B. thuringiensis* ssp. *aizawai*, *B. t.* ssp. *israelensis*, *B. t.* ssp. *galleriae*, *B. t.* ssp. *kurstaki*, *B. t.* ssp. *tenebrionis*, *Beauveria bassiana*, *B. brongniartii*, *Burkholderia* spp., *Chromobacterium subtsugae*, *Cydia pomonella* granulovirut (CpGV), *Cryptophlebia leucotreta* granulovirut (CrleGV), *Flavobacterium* spp., *Helicoverpa armigera* nucleopolyhedrovirut (HearNPV), *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirut (HzNPV), *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirut capsid đơn (HzSNPV), *Heterorhabditis bacteriophora*, *Isaria fumosorosea*, *Lecanicillium longisporum*, *L. muscarium*, *Metarhizium anisopliae*, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, *M. anisopliae* var. *acridum*, *Nomuraea rileyi*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *P. lilacinus*, *Paenibacillus popilliae*, *Pasteuria* spp., *P. nishizawae*, *P. penetrans*, *P. ramosa*, *P. thornea*, *P. usgae*, *Pseudomonas fluorescens*, *Spodoptera littoralis* nucleopolyhedrovirut (SpliNPV), *Steinernema carpocapsae*, *S. feltiae*, *S. kraussei*, *Streptomyces galbus*, *S. microflavus*;

L4) Thuốc diệt sinh vật gây hại sinh hóa có hoạt tính diệt côn trùng, diệt ve bét, diệt nhuyễn thể, có hoạt tính pheromon và/hoặc hoạt tính diệt giun tròn: L-carvone, citral, (E,Z)-7,9-dodecadien-1-yl axetat, etyl format, (E,Z)-2,4-etyl decadienoat (este có mùi lê), (Z,Z,E)-7,11,13-hexadecatrienal, heptyl butyrat, isopropyl myristat, lavanulyl senecioat, cis-jasmone, 2-metyl 1-butanol, metyl eugenol, metyl jasmonat, (E,Z)-2,13-octadecadien-1-ol, (E,Z)-2,13-octadecadien-1-ol axetat, (E,Z)-3,13-octadecadien-1-ol, R-1-octen-3-ol, pentatermanon, (E,Z,Z)-3,8,11-tetradecatrienyl axetat, (Z,E)-9,12-tetradecadien-1-yl axetat, Z-7-tetradecen-2-on, Z-9-tetradecen-1-yl axetat, Z-11-tetradecen, Z-11-tetradecen-1-ol, chiết xuất của *Chenopodium ambrosioides*, dầu Neem, chiết xuất của Quillay;

L5) Các thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh có hoạt tính kích ứng đối với thực vật, điều hòa sự sinh trưởng của thực vật, thúc đẩy và/hoặc tăng cường sự sinh trưởng của thực vật: *Azospirillum amazonense*, *A. brasilense*, *A. lipoferum*, *A. irakense*, *A. halopraeferens*, *Bradyrhizobium* spp., *B. elkanii*, *B. japonicum*, *B. liaoningense*, *B. lupini*, *Delftia acidovorans*, *Glomus intraradices*, *Mesorhizobium* spp., *Rhizobium leguminosarum* bv. *phaseoli*, *R. l.* bv. *trifolii*, *R. l.* bv. *viciae*, *R. tropici*, *Sinorhizobium meliloti*.

Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại từ nhóm L1) và/hoặc L2) cũng có thể có hoạt tính diệt côn trùng, diệt ve bét, diệt nhuễn thể, có hoạt tính pheromon, diệt giun tròn, giảm kích ứng đối với thực vật, điều hòa sinh trưởng thực vật, thúc đẩy sự sinh trưởng và/hoặc tăng cường sản lượng của thực vật. Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại từ nhóm L3) và/hoặc L4) cũng có thể có hoạt tính diệt nấm, diệt vi khuẩn, diệt virus, kích hoạt khả năng phòng vệ của thực vật, giảm kích ứng đối với thực vật, điều hòa sinh trưởng thực vật, thúc đẩy sự sinh trưởng và/hoặc tăng cường sản lượng của thực vật. Các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại từ nhóm L5) cũng có thể có hoạt tính diệt nấm, diệt vi khuẩn, diệt virus, kích hoạt khả năng phòng vệ của thực vật, diệt côn trùng, diệt ve bét, diệt nhuễn thể, có hoạt tính pheromon và/hoặc diệt giun tròn.

Nhiều tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại này đã được đăng ký lưu trữ dưới số đăng ký lưu trữ được nêu ở đây (các tiền tố như ATCC hoặc DSM chỉ chữ viết tắt của nơi thu thập môi trường tương ứng, chi tiết, xem, ví dụ ở đây: http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/), đã được đề cập trong tài liệu kỹ thuật, đã được đăng ký và/hoặc có bán trên thị trường: các hỗn hợp của *Aureobasidium pullulans* DSM 14940 và DSM 14941 được phân lập năm 1989 ở Konstanz, Germany (ví dụ, các bào tử chồi dưới tên BlossomProtect® của bio-ferm GmbH, Austria), *Azospirillum brasilense* Sp245 được phân lập ban đầu ở khu vực trồng lúa mỳ ở miền Nam Brazil (Passo Fundo) ít nhất từ trước năm 1980 (BR 11005; ví dụ, GELFIX® Gramíneas của BASF Agricultural Specialties Ltd., Brazil), *A. brasilense* chủng Ab-V5 và Ab-V6 (ví dụ, ở AzoMax của Novozymes BioAg Produtos papra Agricultura Ltda., Quattro Barras, Brazil hoặc Simbiose-Maíz® của Simbiose-Agro, Brazil; Plant Soil 331, 413-425, 2010), *Bacillus amyloliquefaciens* chủng AP-188 (NRRL B-50615 và B-50331; US 8,445,255); *B. amyloliquefaciens* spp. *plantarum* D747 được phân lập từ không khí ở Kikugawa-shi, Japan (US 20130236522 A1; FERM BP-8234; ví dụ Double Nickel™ 55 WDG của Certis LLC, USA), *B. amyloliquefaciens* spp. *plantarum* FZB24 được phân lập từ đất ở Brandenburg, Germany (còn được gọi là SB3615; DSM 96-2; J. Plant Dis. Prot. 105, 181–197, 1998; ví dụ, Taegro® của Novozyme Biologicals, Inc., USA), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* FZB42 được phân lập từ đất ở Brandenburg, Germany (DSM 23117; J. Plant Dis. Prot.

105, 181–197, 1998; ví dụ RhizoVital® 42 của AbiTEP GmbH, Germany), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* MBI600 được phân lập từ đậu răng ngựa ở Sutton Bonington, Nottinghamshire, U.K. ít nhất trước năm 1988 (còn được gọi là 1430; NRRL B-50595; US 2012/0149571 A1; ví dụ Integral® của BASF Corp., USA), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* QST-713 được phân lập từ vườn đào năm 1995 ở California, U.S.A. (NRRL B-21661; ví dụ Serenade® MAX của Bayer Crop Science LP, USA), *B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum* TJ1000 được phân lập năm 1992 ở South Dakota, U.S.A. (còn được gọi là 1BE; ATCC BAA-390; CA 2471555; ví dụ QuickRoots™ của TJ Technologies, Watertown, SD, USA), *B. firmus* CNCM I-1582, biến thể của chủng gốc EIP-N1 (CNCM I-1556) được phân lập từ đất của vùng đồng bằng trung tâm của Israel (WO 2009/126473, US 6,406,690; ví dụ Votivo® của Bayer CropScience LP, USA), *B. pumilus* GHA 180 được phân lập từ bầu rế cây táo ở Mexico (IDAC 260707-01; ví dụ PRO-MIX® BX của Premier Horticulture, Quebec, Canada), *B. pumilus* INR-7 còn được gọi là BU-F22 và BU-F33 được phân lập ít nhất trước năm 1993 từ dưa chuột bị phá hoại bởi *Erwinia tracheiphila* (NRRL B-50185, NRRL B-50153; US 8,445,255), *B. pumilus* KFP9F được phân lập từ bầu rế cỏ ở Nam Phi ít nhất từ trước 2008 (NRRL B-50754; WO 2014/029697; ví dụ, BAC-UP hoặc FUSION-P của BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South Africa), *B. pumilus* QST 2808 được phân lập từ đất thu thập ở Pohnpei, Federated States of Micronesia, năm 1998 (NRRL B-30087; ví dụ Sonata® hoặc Ballad® Plus của Bayer Crop Science LP, USA), *B. simplex* ABU 288 (NRRL B-50304; US 8,445,255), *B. subtilis* FB17 còn được gọi là UD 1022 hoặc UD10-22 được phân lập từ rễ củ cải đỏ ở North America (ATCC PTA-11857; System. Appl. Microbiol. 27, 372-379, 2004; US 2010/0260735; WO 2011/109395); *B. thuringiensis* ssp. *aizawai* ABTS-1857 được phân lập từ đất lấy từ bãi cỏ ở Ephraim, Wisconsin, U.S.A., năm 1987 (còn được gọi là ABG-6346; ATCC SD-1372; ví dụ XenTari® của BioFa AG, Münsingen, Germany), *B. t.* ssp. *kurstaki* ABTS-351 tương tự với HD-1 được phân lập năm 1967 từ ấu trùng bướm cú bị bệnh ở Brownsville, Texas, U.S.A. (ATCC SD-1275; ví dụ Dipel® DF của Valent BioSciences, IL, USA), *B. t.* ssp. *kurstaki* SB4 được phân lập từ xác ấu trùng *E. saccharina* (NRRL B-50753; ví dụ, Beta Pro® của BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South

Africa), *B. t. ssp. tenebrionis* NB-176-1, thể đột biến của chủng NB-125, chủng kiểu dại được phân lập năm 1982 từ con nhộng chết của sâu bột (beetle *Tenebrio molitor*) (DSM 5383; EP 585 215 B1; ví dụ Novodor® của Valent BioSciences, Switzerland), *Beauveria bassiana* GHA (ATCC 74250; ví dụ BotaniGard® 22WGP của Laverlam Int. Corp., USA), *B. bassiana* JW-1 (ATCC 74040; ví dụ Naturalis® của CBC (Europe) S.r.l., Italy), *B. bassiana* PPRI 5339 được phân lập từ ấu trùng của bọ rùa *Conchyloctenia punctata* (NRRL 50757; ví dụ, BroadBand® của BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South Africa), chủng *Bradyrhizobium elkanii* SEMIA 5019 (còn được gọi là 29W) phân lập được ở Rio de Janeiro, Brazil và SEMIA 587 phân lập được ở 1967 ở State of Rio Grande do Sul, từ vùng đã được chủng ngừa trước với chất phân lập từ Bắc Mỹ, và được sử dụng làm chất chủng ngừa thương mại từ năm 1968 (Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007; ví dụ, GELFIX 5 của BASF Agricultural Specialties Ltd., Brazil), *B. japonicum* 532c phân lập được từ cánh đồng Wisconsin ở Mỹ (Nitragin 61A152; Can. J. Plant. Sci. 70, 661-666, 1990; ví dụ, ở Rhizoflo®, Histick®, Hicoat® Super của BASF Agricultural Specialties Ltd., Canada), *B. japonicum* E-109 biến thể của chủng USDA 138 (INTA E109, SEMIA 5085; Eur. J. Soil Biol. 45, 28–35, 2009; Biol. Fertil. Soils 47, 81–89, 2011); chủng *B. japonicum* được nộp tại SEMIA đã biết từ Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007: SEMIA 5079 được phân lập từ đất ở vùng Cerrados, Brazil bởi Embrapa-Cerrados được sử dụng trong chủng ngừa thương mại từ năm 1992 (CPAC 15; ví dụ, GELFIX 5 hoặc ADHERE 60 từ BASF Agricultural Specialties Ltd., Brazil), *B. japonicum* SEMIA 5080 thu được trong điều kiện phòng thí nghiệm bởi Embrapa-Cerrados ở Brazil và được sử dụng trong chủng ngừa thương mại từ năm 1992, là biến thể tự nhiên của SEMIA 586 (CB1809) được phân lập đầu tiên ở Mỹ (CPAC 7; ví dụ, GELFIX 5 hoặc ADHERE 60 từ BASF Agricultural Specialties Ltd., Brazil); *Burkholderia sp.* A396 được phân lập từ đất ở Nikko, Nhật Bản, vào năm 2008 (NRRL B-50319; WO 2013/032693; Marrone Bio Innovations, Inc., USA), *Coniothyrium minitans* CON/M/91-08 được phân lập từ nho lấy dầu (WO 1996/021358; DSM 9660; ví dụ, Contans® WG, Intercept® WG từ Bayer CropScience AG, Germany), protein harpin (alpha-beta) (Science 257, 85-88, 1992; ví dụ, Messenger™ hoặc HARP-N-Tek từ Plant Health Care plc, U.K.), *Helicoverpa armigera*

nucleopolyhedrovirut (HearNPV) (J. Invertebrate Pathol. 107, 112–126, 2011; ví dụ, Helicovex® từ Adermatt Biocontrol, Switzerland; Diplomata® từ Koppert, Brazil; Vivus® Max từ AgBiTech Pty Ltd., Queensland, Australia), *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirut capsid đơn (HzSNPV) (ví dụ, Gemstar® từ Certis LLC, USA), *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirut ABA-NPV-U (ví dụ, Heligen® từ AgBiTech Pty Ltd., Queensland, Australia), *Heterorhabditis bacteriophora* (ví dụ, Nemasys® G từ BASF Agricultural Specialities Limited, UK), *Isaria fumosorosea* Apopka-97 được phân lập từ rệp bột trên chi Kim thất ở Apopka, Florida, U.S.A. (ATCC 20874; Biocontrol Science Technol. 22(7), 747-761, 2012; ví dụ PFR-97™ hoặc PreFeRal® của Certis LLC, USA), *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* F52 còn được gọi là 275 hoặc V275 được phân lập từ bướm codling moth ở Áo (DSM 3884, ATCC 90448; ví dụ Met52® Novozymes Biologicals BioAg Group, Canada), *Metschnikowia fructicola* 277 được phân lập từ quả nho ở vùng trung tâm của Israel (US 6,994,849; NRRL Y-30752; ví dụ trước đây là Shemer® của Agrogreen, Israel), *Paecilomyces ilacinus* 251 được phân lập từ trứng giun tròn bị nhiễm ở Philippines (AGAL 89/030550; WO1991/02051; Crop Protection 27, 352-361, 2008; ví dụ BioAct® của Bayer CropScience AG, Germany và MeloCon® của Certis, USA), *Paenibacillus alvei* NAS6G6 được phân lập từ bầu rế cỏ ở Nam Phi ít nhất trước năm 2008 (WO 2014/029697; NRRL B-50755; ví dụ, BAC-UP của BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South Africa), *Pasteuria nishizawae* Pn1 được phân lập từ cánh đồng đậu nành vào giữa những năm 2000 ở Illinois, U.S.A. (ATCC SD-5833; Federal Register 76(22), 5808, 02/02/2011; ví dụ Clariva™ PN của Syngenta Crop Protection, LLC, USA), *Penicillium bilaiae* (còn được gọi là *P. bilaii*) các chủng ATCC 18309 (= ATCC 74319), ATCC 20851 và/hoặc ATCC 22348 (= ATCC 74318) có nguồn gốc phân lập từ đất ở Alberta, Canada (Fertilizer Res. 39, 97-103, 1994; Can. J. Plant Sci. 78(1), 91-102, 1998; US 5,026,417, WO 1995/017806; ví dụ Jump Start®, Provide® của Novozymes Biologicals BioAg Group, Canada), chiết xuất *Reynoutria sachalinensis* (EP 0307510 B1; ví dụ Regalia® SC của Marrone BioInnovations, Davis, CA, USA hoặc Milsana® của BioFa AG, Germany), *Steinernema carpocapsae* (ví dụ Millenium® của BASF Agricultural Specialities Limited, UK), *S. feltiae* (ví dụ Nemashield® của BioWorks, Inc.,

USA; Nemasys® của BASF Agricultural Specialities Limited, UK), *Streptomyces microflavus* NRRL B-50550 (WO 2014/124369; Bayer CropScience, Germany), *Trichoderma asperelloides* JM41R được phân lập ở Nam Phi (NRRL 50759; còn được gọi là *T. fertile*; ví dụ, Trichoplus® của BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South Africa), *T. harzianum* T-22 còn được gọi là KRL-AG2 (ATCC 20847; BioControl 57, 687-696, 2012; ví dụ Plantshield® của BioWorks Inc., USA hoặc SabrEx™ của Advanced Biological Marketing Inc., Van Wert, OH, USA).

Theo sáng chế, nguyên liệu rắn (chất khô) của các tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại (loại trừ các dầu như dầu Neem) được xem xét là các thành phần có hoạt tính (ví dụ thu được sau khi làm khô hoặc bay hơi môi trường chiết xuất hoặc huyền phù trong trường hợp các chế phẩm lỏng là thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh).

Theo sáng chế, tỷ lệ khối lượng và phần trăm được sử dụng ở đây đối với chiết xuất sinh học như chiết xuất Quillay được tính trên tổng lượng chất khô (chất rắn) của (các) chiết xuất tương ứng.

Tổng tỷ lệ khối lượng của các chế phẩm chứa ít nhất một thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh ở dưới dạng các tế bào vi sinh vật có thể tồn tại bao gồm các dạng tạm thời không hoạt động, có thể được xác định bằng cách sử dụng lượng CFU của vi sinh vật tương ứng để tính tổng khối lượng của thành phần hoạt tính tương ứng với phương trình là 1×10^{10} CFU tương đương với một gram tổng khối lượng của thành phần hoạt tính tương ứng. Đơn vị tạo khuẩn lạc (CFU - Colony forming unit) là số đo các tế bào vi sinh vật có thể tồn tại, cụ thể là các tế bào nấm và tế bào vi khuẩn. Ngoài ra, trong bản mô tả này “CFU” có thể còn được hiểu là số lượng các con giun tròn riêng rẽ (mới sinh) trong trường hợp tác nhân sinh học diệt sinh vật gây hại là giun tròn (gây bệnh cho côn trùng), như *Steinernema feltiae*.

Nếu hỗn hợp chứa các thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh được sử dụng để bảo vệ cây trồng thì Tỷ lệ dùng tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1×10^6 đến 5×10^{15} (hoặc hơn thế) CFU/ha, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1×10^8 đến khoảng 1×10^{13} CFU/ha, và thậm chí tốt hơn nữa là từ khoảng 1×10^9 đến khoảng 1×10^{12} CFU/ha. Trong trường hợp giun tròn (gây bệnh trên côn trùng) làm thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn

gốc vi sinh (ví dụ *Steinernema feltiae*), tỷ lệ sử dụng tốt hơn là trong khoảng từ 1×10^5 đến 1×10^{12} (hoặc lớn hơn), tốt hơn nữa là từ 1×10^8 đến 1×10^{11} , còn tốt hơn nữa là từ 5×10^8 đến 1×10^{10} cá thể (ví dụ ở dạng trứng, ấu trùng hoặc giai đoạn sống bất kỳ khác, tốt hơn là ở giai đoạn gần ấu trùng) trên một hecta.

Nếu hỗn hợp chứa các thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh được sử dụng trong xử lý hạt giống thì tỷ lệ dùng đối với vật liệu nhân giống thực vật tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1×10^6 đến 1×10^{12} (hoặc nhiều hơn) CFU/hạt giống. Tốt hơn là, nồng độ này là khoảng 1×10^6 đến khoảng 1×10^9 CFU/hạt giống. Trong trường hợp thuốc diệt sinh vật gây hại có nguồn gốc vi sinh II, tỷ lệ dùng đối với vật liệu nhân giống thực vật còn tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1×10^7 đến 1×10^{14} (hoặc hơn thế) CFU trên 100 kg hạt giống, tốt hơn là từ 1×10^9 đến khoảng 1×10^{12} CFU trên 100 kg hạt giống.

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm hóa nông chứa chất bổ trợ và ít nhất một hợp chất theo sáng chế hoặc hỗn hợp của nó.

Chế phẩm hoá nông bao gồm lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại của hợp chất theo sáng chế hoặc hỗn hợp của nó. Thuật ngữ "lượng hữu hiệu diệt sinh vật gây hại" được định nghĩa dưới đây.

Các hợp chất theo sáng chế hoặc hỗn hợp của chúng có thể được chuyển hóa thành các loại chế phẩm hóa-nông thông dụng, chẳng hạn dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, dịch đặc, hạt, dạng nén, viên nang, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về các loại chế phẩm là huyền phù (ví dụ SC, OD, FS), dịch cô đặc có thể nhũ hóa (ví dụ EC), nhũ tương (ví dụ EW, EO, ES, ME), viên nang (ví dụ CS, ZC), dịch đặc, viên thuốc hình thoi, bột hoặc bụi có thể thấm ướt được (ví dụ WP, SP, WS, DP, DS), dạng nén (ví dụ BR, TB, DT), hạt (ví dụ WG, SG, GR, FG, GG, MG), các vật phẩm chứa thuốc trừ côn trùng (ví dụ LN), cũng như là chế phẩm dạng gel để xử lý vật liệu nhân giống thực vật như hạt (ví dụ GF). Các loại chế phẩm này và các loại chế phẩm khác nữa được định nghĩa trong tài liệu "Catalogue of pesticide formulation types và 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 và Grubemann trong tài liệu Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; hoặc bởi

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

Ví dụ về các chất bổ trợ thích hợp là dung môi, chất mang lỏng, chất mang rắn hoặc chất làm đầy, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất làm ướt, tá dược, chất hòa tan, chất tăng cường tính thấm, chất keo bảo vệ, chất bám dính, chất làm đặc, chất giữ độ ẩm, chất xua đuổi côn trùng, chất dẫn dụ côn trùng, chất kích thích ăn, chất tương thích hóa, chất diệt khuẩn, chất chống đóng băng, chất chống tạo bọt, chất màu, chất dính và chất kết dính.

Dung môi và chất mang lỏng thích hợp là nước và dung môi hữu cơ, như các phân đoạn dầu khoáng có điểm sôi từ trung bình đến cao, chẳng hạn kerosen, dầu diesel; dầu có nguồn gốc thực vật hoặc động vật; hydrocacbon béo, vòng và thơm, chẳng hạn toluen, parafin, tetrahydronaphtalen, naphtalen được alkylat hóa; rượu, chẳng hạn etanol, propanol, butanol, rượu benzylic, xyclohexanol; glycol; DMSO; keton, chẳng hạn xyclohexanon; este, chẳng hạn lactat, cacbonat, este của axit béo, gama-butyrolacton; axit béo; phosphonat; amin; amit, chẳng hạn N-metylpyrrolidon, dimetylamit của axit béo; và hỗn hợp của chúng.

Chất mang rắn hoặc chất làm đầy rắn thích hợp là đất khoáng, chẳng hạn silicat, silicagel, bột talc, cao lanh, đá vôi, vôi sống, đá phấn, đất sét, đô-lô-mít, diatomit, bentonit, canxi sulfat, magie sulfat, magie oxit; bột polysacarit, chẳng hạn xenluloza, tinh bột; phân bón, chẳng hạn amoni sulfat, amoni phosphat, amoni nitrat, ure; các sản phẩm có nguồn gốc thực vật, chẳng hạn bột ngũ cốc, bột vỏ cây, bột gỗ, bột vỏ quả hạch, và hỗn hợp của chúng.

Các chất hoạt động bề mặt thích hợp là các hợp chất có hoạt tính bề mặt, như chất hoạt động bề mặt dạng anion, cation, không ion và lưỡng tính, polyme khối, chất điện phân có khối lượng phân tử cao, và hỗn hợp của chúng. Các chất hoạt động bề mặt như vậy có thể được sử dụng làm chất nhũ hóa, chất phân tán, chất hòa tan, chất làm ướt, chất tăng cường tính thấm, keo bảo vệ, hoặc tá dược. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt được liệt kê trong tài liệu McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. hoặc North American Ed.).

Chất hoạt động bề mặt anion thích hợp là kiềm, kiềm thổ hoặc muối amoni của sulfonat, sulfat, phosphat, carboxylat, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về sulfonat là alkylarylsulfonat, diphenylsulfonat, alpha-olefin sulfonat, lignin sulfonat, sulfonat của axit béo và dầu, sulfonat của alkylphenol được etoxy hóa, sulfonat của arylphenol được alcoxyl hóa, sulfonat của naphthalen được ngưng tụ, sulfonat của dodexyl- và tridexylbenzen, của naphthalen và alkyl naphthalen, sulfosuccinat hoặc sulfosuccinamat. 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 của axit béo. Ví dụ về phosphat là phosphat este. Ví dụ về carboxylat là alkyl carboxylat, và rượu carboxylat hoá hoặc alkylphenol etoxylat.

Chất hoạt động bề mặt không ion thích hợp là alcoxylat, amit của axit béo được thế ở N, amin oxit, este, chất hoạt động bề mặt trên cơ sở đường, chất hoạt động bề mặt polyme, và hỗn hợp của chúng. Ví dụ về alcoxylat là các hợp chất như rượu, alkylphenol, amin, amit, arylphenol, axit béo hoặc este của axit béo đã được alcoxyl hóa với 1 đến 50 đương lượng. Etylen oxit và/hoặc propylen oxit có thể được dùng cho phản ứng alcoxyl hóa, tốt hơn là etylen oxit. Ví dụ về amit của axit béo được thế tại N là glucamit của axit béo hoặc alkanolamit của axit béo. Ví dụ về este là este của axit béo, glyxerol este hoặc monoglyxerit. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt có gốc đường là sorbitan, sorbitan được etoxy hóa, sucroza và glucoza este hoặc alkylpolyglucosit. Ví dụ về chất hoạt động bề mặt polyme là homo- hoặc copolyme của vinylpyrrolidon, rượu vinylic, hoặc vinylaxetat.

Chất hoạt động bề mặt cation thích hợp là chất hoạt động bề mặt bậc bốn, ví dụ hợp chất amoni bậc bốn với một hoặc hai nhóm kỵ nước, hoặc muối của amin bậc nhất mạch dài. Chất hoạt động bề mặt lưỡng tính thích hợp là alkylbetain và imidazolin. Polyme khối thích hợp là polyme khối thuộc loại A-B hoặc A-B-A bao gồm các khối polyetylen oxit và polypropylen oxit, hoặc thuộc loại A-B-C bao gồm alkanol, polyetylen oxit và polypropylen oxit. Chất điện phân có khối lượng phân tử cao thích hợp là polyaxit hoặc polybazơ. Ví dụ về polyaxit là muối kiềm của axit polyacrylic hoặc polyme hình răng lược gồm các polyaxit. Ví dụ về polybazơ là polyvinylamin hoặc polyetylenamin.

Tá dược thích hợp là các hợp chất, mà có hoạt tính diệt sinh vật gây hại không đáng kể hoặc thậm chí là không có hoạt tính diệt sinh vật gây hại, và giúp cải thiện đặc tính sinh

học của hợp chất theo sáng chế trên đích. Các ví dụ là chất hoạt động bề mặt, dầu khoáng hoặc dầu thực vật, và các chất bổ trợ khác. Các ví dụ khác được liệt kê bởi tác giả Knowles, trong tài liệu Adjuvants và additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Chất làm đặc thích hợp là polysacarit (chẳng hạn gồm xanthan, carboxymethylxenluloza), đất sét vô cơ (được cải biến hữu cơ hoặc chưa được cải biến), polycarboxylat, và silicat.

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

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

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

Ví dụ về các loại chế phẩm và phương pháp bào chế chúng là:

i) Dịch cô đặc hòa tan trong nước (SL, LS)

10-60% khối lượng của hợp chất có công thức I theo sáng chế và 5-15% khối lượng chất thấm ướt (ví dụ rượu alkoxylat) được hòa tan trong nước và/hoặc trong dung môi hòa tan trong nước (ví dụ rượu) được bổ sung đến 100% khối lượng. Hoạt chất hòa tan nhờ pha loãng với nước.

ii) Dịch cô đặc có thể phân tán (Dispersible concentrates - DC)

5-25% khối lượng hợp chất I theo sáng chế và 1-10% khối lượng chất phân tán (ví dụ, polyvinylpyrrolidon) được hòa tan trong đến 100% khối lượng dung môi hữu cơ (ví dụ, xyclohexanon). Pha loãng với nước để tạo ra thể phân tán.

iii) Dịch cô đặc có thể nhũ hóa (Emulsifiable concentrates - EC)

15-70% khối lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế và 5-10% khối lượng chất nhũ hóa (chẳng hạn canxi dodexylbenzensulfonat và etoxyl của dầu thầu dầu) được hòa tan trong đến 100% khối lượng dung môi hữu cơ không hòa tan trong nước (chẳng hạn hydrocacbon thơm). Pha loãng với nước để tạo ra nhũ tương.

iv) Nhũ tương (EW, EO, ES)

5-40% khối lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế và 1-10% khối lượng chất nhũ hóa (chẳng hạn canxi dodexylbenzensulfonat và etoxyl của dầu thầu dầu) được hòa tan trong 20-40% khối lượng dung môi hữu cơ không hòa tan trong nước (chẳng hạn hydrocacbon thơm). Hỗn hợp này được đưa vào nước mà được bổ sung đến 100% khối lượng nước bằng thiết bị nhũ hóa và tạo thành nhũ tương đồng nhất. Pha loãng với nước để tạo ra nhũ tương.

v) Huyền phù (SC, OD, FS)

Trong thiết bị nghiền bi có khuấy, 20-60% khối lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế được nghiền nhỏ có bổ sung 2-10% khối lượng chất phân tán và chất thấm ướt (chẳng hạn natri lignosulfonat và rượu etoxylat), 0,1-2% khối lượng chất làm đặc (chẳng hạn gôm xanthan) và nước được bổ sung đến 100% khối lượng nước để thu được huyền phù chứa hoạt chất ở dạng mịn. Pha loãng với nước thu được huyền phù ổn định chứa hoạt chất. Đối với chế phẩm loại FS, tới 40% khối lượng chất kết dính (ví dụ, rượu polyvinyllic) được bổ sung.

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

50-80% khối lượng của hợp chất có công thức I theo sáng chế được nghiền mịn có bổ sung chất phân tán và chất thấm ướt (chẳng hạn natri lignosulfonat và rượu etoxylat) được bổ sung đến 100% khối lượng và được điều chế như hạt có thể phân tán trong nước hoặc hạt hòa tan trong nước bằng các thiết bị kỹ thuật (chẳng hạn ép đùn, tháp phun, tầng sôi). Pha loãng với nước thu được thể phân tán hoặc dung dịch ổn định chứa hoạt chất.

vii) Bột có thể phân tán trong nước và bột 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 rôto-stato có bổ sung 1-5% khối lượng chất phân tán (chẳng hạn natri lignosulfonat), 1-3% khối lượng chất thấm ướt (chẳng hạn rượu etoxylat) và chất mang rắn, chẳng hạn

silica gel được bổ sung đến 100% khối lượng. Pha loãng với nước thu được thể phân tán hoặc dung dịch ổn định chứa hoạt chất.

viii) Gel (GW, GF)

Trong thiết bị nghiền bi có khuấy, 5-25% khối lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế được nghiền nhỏ có bổ sung 3-10% khối lượng chất phân tán (chẳng hạn natri lignosulfonat), 1-5% khối lượng chất làm đặc (chẳng hạn carboxymetylxenluloza) và nước được bổ sung đến 100% khối lượng nước để thu được huyền phù mịn chứa hoạt chất. Pha loãng với nước thu được huyền phù ổn định chứa hoạt chất.

ix) Vi nhũ tương (ME)

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

x) 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 hòa tan trong nước (chẳng hạn hydrocacbon thơm), 2-15% khối lượng acrylic monome (chẳng hạn metylmetacrylat, axit metacrylic và di- hoặc triacrylat) được phân tán vào dung dịch chứa keo bảo vệ trong nước (chẳng hạn rượu polyvinyllic). Phản ứng polyme hóa gốc được khơi mào bằng chất khơi mào gốc, dẫn đến tạo thành vi nang poly(met)acrylat. Theo cách khác, 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 hòa tan trong nước (chẳng hạn hydrocacbon thơm), và monome isoxyanat (chẳng hạn diphenylmeten-4,4'-diisoxyanat) được phân tán vào dung dịch keo bảo vệ trong nước (chẳng hạn rượu polyvinyllic). Việc bổ sung polyamin (chẳng hạn hexametylendiamin) dẫn đến tạo thành vi nang polyure. Lượng monome đến 1-10% khối lượng. % khối lượng so với tổng chế phẩm CS.

xi) Bột có thể ở dạng bụi (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, chẳng hạn cao lanh đã được nghiền mịn được bổ sung đến 100% khối lượng.

xii) 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 (chẳng hạn silicat) được bổ sung đến 100% khối lượng. Bước tạo hạt đạt được bằng cách ép đùn, sấy phun hoặc tăng sôi.

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

1-50% khối lượng hợp chất có công thức I theo sáng chế được hòa tan trong dung môi hữu cơ, chẳng hạn hydrocarbon thơm được bổ sung đến 100% khối lượng.

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

Chế phẩm hóa nông thường chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 95%, tốt hơn là từ 0,1 đến 90%, tốt hơn nhất là từ 0,5 đến 75%, khối lượng. Hoạt chất được dùng với độ tinh khiết từ 90% đến 100%, tốt hơn là từ 95% đến 100% (theo phổ NMR).

Các loại dầu, chất thấm ướt, tá dược, phân bón, hoặc các chất vi lượng khác nhau, và các thuốc trừ dịch hại khác (chẳng hạn thuốc diệt cỏ, thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt nấm, chất điều hòa sinh trưởng, chất tăng cường khả năng tương thích cho cây trồng) có thể được bổ sung vào các hoạt chất hoặc chế phẩm chứa chúng ở dạng hỗn hợp trộn trước hoặc, nếu thích hợp không được bổ sung cho đến ngay trước khi sử dụng (hỗn hợp trộn trong thùng). Các chất này có thể được trộn lẫn với các chế phẩm theo sáng chế ở tỷ lệ khối lượng từ 1:100 đến 100:1, tốt hơn là 1:10 đến 10:1.

Người sử dụng áp dụng chế phẩm theo sáng chế thường từ thiết bị liều định trước, thiết bị phun đeo vai, bình phun, máy bay phun, hoặc hệ thống tưới. Thông thường, chế phẩm hóa nông được điều chỉnh đến nồng độ mong muốn bằng cách bổ sung nước, dung dịch đệm, và/hoặc các chất bổ trợ khác và thu được chất lỏng dùng ngay để phun hoặc chế phẩm hóa nông theo sáng chế. Thông thường, 20 đến 2000 lít, tốt hơn là 50 đến 400 lít, chất lỏng dùng ngay để phun được dùng trên một diện tích hữu ích trong nông nghiệp.

Theo một phương án, 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 bởi chính người sử dụng trong thùng phun và các chất bổ trợ khác có thể được bổ sung, nếu thích hợp.

Theo một phương án khác, các thành phần riêng rẽ của chế phẩm theo sáng chế hoặc các thành phần đã được trộn trước một phần chẳng hạn các thành phần chứa hợp chất theo sáng chế và/hoặc các thành phần trộn như được xác định trên đây, có thể được trộn bởi người sử dụng trong thùng phun và các chất bổ trợ và các chất phụ gia khác có thể được bổ sung, nếu thích hợp.

Theo một phương án khác, các thành phần riêng rẽ của chế phẩm theo sáng chế hoặc các thành phần đã được trộn trước một phần, chẳng hạn các thành phần chứa hợp chất theo sáng chế và/hoặc các thành phần trộn như được xác định trên đây, có thể được dùng cùng nhau (chẳng hạn sau khi trộn trong thùng) hoặc dùng lần lượt.

Hợp chất theo sáng chế thích hợp để dùng trong bảo vệ cây mùa vụ, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, như hạt, hoặc đất hoặc nước, trong đó thực vật đang phát triển, khỏi sự tấn công hoặc lây nhiễm động vật gây hại. Do đó, sáng chế còn đề xuất phương pháp bảo vệ thực vật, bao gồm cho cây mùa vụ, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, như hạt, hoặc đất hoặc nước, trong đó thực vật đang phát triển, được bảo vệ khỏi sự tấn công hoặc lây nhiễm động vật gây hại, tiếp xúc với lượng có tác dụng diệt loài gây hại của hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế cũng thích hợp để sử dụng nhằm chống lại và phòng trừ động vật gây hại. Theo đó, sáng chế cũng đề xuất phương pháp chống lại hoặc phòng trừ động vật gây hại, phương pháp này bao gồm bước cho động vật gây hại, môi trường sống của chúng hoặc nơi sinh sản của chúng hoặc nguồn cung cấp thức ăn của chúng, hoặc cây trồng, thực vật, vật liệu nhân giống thực vật như hạt, đất, bề mặt, vật liệu hoặc môi trường mà trong đó động vật gây hại đang sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng, tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt sinh vật gây hại của hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế là hữu hiệu qua cả đường tiếp xúc và nuốt vào bụng. Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng ở bất kỳ và toàn bộ các giai đoạn phát triển, như trứng, ấu trùng, nhộng, và trưởng thành.

Hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng ở dạng sẵn có hoặc ở dạng chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế như được xác định trên đây. Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng cùng với các thành phần trộn như được xác định trên đây hoặc ở dạng chế phẩm chứa hỗn hợp này như được xác định trên đây. Các hợp phần của hỗn hợp này có thể được áp dụng đồng thời, cùng nhau hoặc riêng biệt, hoặc liên tiếp, nghĩa là hợp phần này ngay sau hợp phần khác và nhờ đó, tạo ra hỗn hợp "tại chỗ" ở vị trí mong muốn, ví dụ, thực vật, dây, trong trường hợp áp dụng riêng biệt, thường không có ảnh hưởng bất kỳ nào đến kết quả đo tác dụng phòng trừ.

Việc áp dụng có thể được thực hiện cả trước và sau khi thực vật, vật liệu nhân giống thực vật, như hạt, đất, khu vực, vật liệu hoặc môi trường bị gây hại bởi sinh vật gây hại.

Phương pháp áp dụng thích hợp bao gồm, trong số những cái khác, xử lý đất, xử lý hạt, áp dụng theo luống, và áp dụng cho lá. Phương pháp xử lý đất bao gồm tưới ẩm đất, tưới nhỏ giọt (nhỏ giọt vào đất), nhúng rễ, thân củ hoặc rễ củ, hoặc phun vào đất. Kỹ thuật xử lý hạt bao gồm tạo áo hạt, phủ hạt, quét bụi lên hạt, ngâm hạt, tạo viên trên hạt. Việc dùng tại luống thường bao gồm bước đánh luống đất trồng, gieo hạt vào luống, đưa hợp chất có hoạt tính diệt loài gây hại vào luống, và đóng luống. Việc dùng cho lá dùng để chỉ việc dùng có hoạt tính diệt loài gây hại cho lá cây, ví dụ, bằng thiết bị phun. Để dùng cho lá, có lợi nếu có thể cải biến hành vi của loài gây hại bằng cách sử dụng chất dẫn dụ kết hợp với hợp chất theo sáng chế. Chất dẫn dụ thích hợp cho cây mùa vụ và loài gây hại cụ thể là đã được người có kiến thức trung bình trong lĩnh vực này biết đến và được công bố trên cơ sở dữ liệu về chất dẫn dụ và hóa chất truyền tin, như <http://www.pherobase.com>.

Như được sử dụng trong bản mô tả này, thuật ngữ "cho tiếp xúc" bao gồm cả việc tiếp xúc trực tiếp (áp dụng hợp chất/chế phẩm trực tiếp lên động vật gây hại hoặc thực vật - thường cho lá, thân hoặc rễ của thực vật) và tiếp xúc gián tiếp (áp dụng hợp chất/chế phẩm cho nơi ở, nghĩa là môi trường sống, nơi sinh sản, thực vật, hạt, đất, bề mặt, vật liệu

hoặc môi trường mà trong đó sinh vật gây hại đang sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng, của động vật gây hại hoặc thực vật).

Thuật ngữ “động vật gây hại” bao gồm động vật chân khớp, động vật chân bụng, và giun tròn. Động vật gây hại được ưu tiên theo sáng chế là động vật chân khớp, tốt hơn là côn trùng và động vật lớp nhện, đặc biệt là côn trùng. Côn trùng, mà có liên quan đặc biệt với cây trồng, thường dùng để chỉ côn trùng gây hại cho cây trồng.

Thuật ngữ "cây trồng" dùng để chỉ cả cây trồng đang sinh trưởng và đã thu hoạch.

Thuật ngữ “thực vật” bao gồm cả ngũ cốc, ví dụ, lúa mì cứng và lúa mì khác, lúa mạch đen, lúa mạch, tiểu hắc mạch, yến mạch, cây lúa, hoặc ngô (ngô chăn nuôi và ngô lấy đường / ngô ngọt và ngô ruộng); dòng củ cải đường, ví dụ, củ cải đường hoặc củ cải dùng trong chăn nuôi; quả, như táo, quả hạch hoặc quả mềm, ví dụ, táo, lê, mận, đào, xuân đào, quả hạnh, anh đào, đu đủ, dâu tây, quả quả mâm xôi, mâm xôi đen hoặc quả lý gai; thực vật họ đậu, như đậu, đậu lăng, đậu Hà Lan, cỏ linh lăng hoặc đậu tương; thực vật lấy dầu, như cây cải dầu (hạt cải dầu), cải ngọt, mù-tạt, ôliu, hướng dương, dừa, hạt ca cao, thầu dầu, cọ dầu, lạc hoặc đậu tương; họ bầu bí, như bí, bí ngô, dưa chuột hoặc dưa; thực vật lấy sợi, như bông, lanh, gai dầu hoặc đay; quả họ cam quýt, như cam, chanh, bưởi hoặc quýt; các loại rau, như cà, rau bi-na, rau diếp (ví dụ, rau diếp băng), rau diếp xoăn, rau cải, măng tây, rau cải, cà rốt, hành, tỏi, tỏi tây, cà chua, khoai tây, họ bầu bí hoặc ớt ngọt; thực vật họ long não, như lê tàu, quế hoặc long não; thực vật lấy năng lượng và nguyên liệu thô, như ngô, đậu tương, cây cải dầu, mía đường hoặc cọ dầu; thuốc lá; quả hạch, ví dụ, cây óc chó; cây hồ trăn; cà phê; chè; chuối; nho (nho ăn và nho dùng làm nước ép nho); hu blong; rau ngót (còn được gọi là Stevia); cao su tự nhiên hoặc thực vật cảnh và thực vật trồng rừng, như hoa (ví dụ, cẩm chướng, dã yên thảo, phong lữ/quỳ thiên trúc, păng - xê và cây bóng nước), cây bụi, cây lá rộng (ví dụ, cây dương) hoặc cây thường xanh, ví dụ, cây có quả hình nón; cây khuynh diệp; cỏ; bãi cỏ; cỏ như cỏ dùng để chăn nuôi động vật hoặc sử dụng làm cảnh. Thực vật ưu tiên bao gồm khoai tây, củ cải đường, thuốc lá, lúa mì, lúa mạch đen, lúa mạch, yến mạch, cây lúa, ngô, bông, đậu tương, cây cải dầu, cây họ đậu, hướng dương, cà phê hoặc mía đường; quả; nho; cây cảnh; hoặc các loại rau, như dưa chuột, cà chua, đậu hoặc bí.

Thuật ngữ “thực vật” cần được hiểu là bao gồm thực vật loại hoang dại và thực vật mà đã được làm biến đổi bằng phương pháp nhân giống thông thường hoặc phương pháp gây đột biến hoặc công nghệ di truyền, hoặc bằng sự kết hợp của các phương pháp này.

Thực vật mà đã được làm biến đổi bằng phương pháp gây đột biến hoặc công nghệ di truyền, và có tầm quan trọng đặc biệt về thương mại bao gồm cỏ linh lăng, cây cải dầu (ví dụ, hạt cải dầu), đậu, củ cải đường, rau diếp xoăn, bông, cà, cây khuy nh diệp, lanh, đậu lăng, ngô, dưa, đu đủ, dã yên thảo, mận, cây dương, khoai tây, cây lúa, đậu tương, bí, củ cải đường, mía đường, hướng dương, ớt ngọt, thuốc lá, cà chua, và ngũ cốc (ví dụ, lúa mì), đặc biệt là ngô, đậu tương, bông, lúa mì, và lúa gạo. Ở thực vật mà đã được làm biến đổi bằng phương pháp gây đột biến hoặc công nghệ di truyền, một hoặc nhiều gen đã được gây đột biến hoặc được hợp nhất vào vật liệu di truyền của thực vật. Một hoặc nhiều gen được gây đột biến hoặc hợp nhất tốt hơn được chọn từ *pat*, *epsps*, *cry1Ab*, *bar*, *cry1Fa2*, *cry1Ac*, *cry34Ab1*, *cry35AB1*, *cry3A*, *cryF*, *cry1F*, *mcry3a*, *cry2Ab2*, *cry3Bb1*, *cry1A.105*, *dfr*, *barnase*, *vip3Aa20*, *barstar*, *als*, *bxn*, *bp40*, *asn1*, và *ppo5*. Phương pháp gây đột biến hoặc hợp nhất một hoặc nhiều gen được tiến hành nhằm để cải thiện một số đặc tính của thực vật. Các đặc tính như vậy, còn được biết là các tính trạng, bao gồm tính chịu áp lực phi sinh học, đặc tính sinh trưởng/năng suất thay đổi, tính kháng bệnh, tính chịu chất diệt cỏ, tính kháng côn trùng, đặc tính chất lượng sản phẩm được cải biến, và đặc tính kiểm soát sự thụ phấn. Trong số các đặc tính này, đặc tính chịu thuốc diệt cỏ, ví dụ, chịu thuốc diệt cỏ imidazolinone, chịu glyphosate, hoặc chịu glufosinate, là đặc tính quan trọng nhất. Nhiều thực vật đã được truyền đặc tính chịu thuốc diệt cỏ bằng phương pháp gây đột biến, ví dụ, cải dầu Clearfield® chịu được các thuốc diệt cỏ imidazolinone, ví dụ, imazamox. Theo cách khác, các phương pháp công nghệ di truyền đã được sử dụng để truyền cho thực vật, như đậu tương, bông, ngô, củ cải đường và cây cải dầu, đặc tính chịu được các thuốc diệt cỏ, như glyphosate và glufosinate, một số thực vật này có sẵn trên thị trường dưới các tên thương mại RoundupReady® (glyphosate) và LibertyLink® (glufosinate). Ngoài ra, đặc tính kháng côn trùng là đặc tính quan trọng, nhất là đặc tính kháng côn trùng thuộc bộ cánh vẩy và đặc tính kháng côn trùng thuộc bộ cánh cứng. Đặc tính kháng côn trùng điển hình thu được bằng cách làm biến đổi thực vật bằng cách hợp nhất các gen *cry* và/hoặc *vip*, các

gen này các gen này được phân lập từ *Bacillus thuringiensis* (Bt), và mã hóa cho các độc tố Bt riêng biệt. Thực vật biến đổi gen với đặc tính kháng côn trùng có sẵn trên thị trường dưới các tên thương mại bao gồm WideStrike®, Bollgard®, Agrisure®, Herculex®, YieldGard®, Genuity®, và Intacta®. Thực vật có thể được làm biến đổi bằng phương pháp gây đột biến hoặc công nghệ di truyền liên quan đến một đặc tính (các tính trạng đơn) hoặc liên quan đến một tổ hợp đặc tính (các tính trạng kết hợp). Các tính trạng kết hợp, ví dụ, tổ hợp của tính trạng chịu thuốc diệt cỏ và kháng côn trùng, là tính trạng kết hợp quan trọng. Nói chung, tất cả các thực vật cải biến thích hợp liên quan đến các tính trạng đơn hoặc tính trạng kết hợp cũng như thông tin chi tiết về các gen được gây đột biến hoặc hợp nhất và các sự kiện tương ứng đều có sẵn trên các trang web của các tổ chức “International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications (ISAAA)” (<http://www.isaaa.org/gmapprovaldatabase>) và “Center for Environmental Risk Assessment (CERA)” (<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>).

Một cách ngạc nhiên đã phát hiện ra rằng, hoạt tính trừ dịch hại của hợp chất theo sáng chế có thể được tăng cường bởi tính trạng diệt côn trùng của thực vật cải biến. Ngoài ra, đã phát hiện ra rằng, hợp chất theo sáng chế thích hợp để phòng ngừa côn trùng trở nên kháng lại tính trạng diệt côn trùng hoặc để chống lại các loài gây hại mà chúng đã trở nên kháng lại tính trạng diệt côn trùng của thực vật cải biến. Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế thích hợp để chống lại các sinh vật gây hại mà tính trạng diệt côn trùng không có hiệu quả đối với chúng, sao cho hoạt tính diệt côn trùng bổ sung có thể được sử dụng một cách thuận lợi.

Thuật ngữ "vật liệu nhân giống thực vật" dùng để chỉ tất cả các bộ phận sinh sản của thực vật như hạt và vật liệu sinh dưỡng của thực vật như các phần cắt chiết và thân củ (ví dụ, khoai tây), mà các bộ phận này có thể được sử dụng để nhân giống thực vật. Các bộ phận này bao gồm hạt, rễ, quả, thân củ, hành, thân rễ, thân chồi, mầm và các bộ phận khác của thực vật. Cây giống con và thực vật non mà chúng có thể được cấy chuyển sau khi nảy mầm hoặc sau khi nhú khỏi mặt đất, cũng có thể được bao gồm. Các vật liệu nhân giống thực vật này có thể được xử lý theo kiểu dự phòng bằng hợp chất bảo vệ thực vật tại thời điểm hoặc trước thời điểm trồng hoặc cấy chuyển.

Thuật ngữ “hạt” bao gồm hạt và cành giâm thực vật của tất cả các loại bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở hạt thật sự, các loại hạt, chồi rễ mứt, giò ngâm, củ, quả, thân củ, hạt giống, các phần chiết, thân chồi cắt và bộ phận tương tự, và trong một phương án ưu tiên, có nghĩa là hạt thật sự.

Thông thường, "lượng hữu hiệu trong việc diệt sinh vật dịch hại" có nghĩa lượng thành phần hoạt tính cần để đạt được tác dụng có thể nhìn thấy được đối với sự sinh trưởng, bao gồm tác dụng hoại tử, chết, trì hoãn, phòng ngừa, và loại bỏ, tiêu diệt, hoặc làm giảm bớt theo cách khác sự xuất hiện và hoạt tính của sinh vật đích. Lượng hữu hiệu trong việc diệt sinh vật gây hại có thể thay đổi đối với các hợp chất/chế phẩm khác nhau được sử dụng trong sáng chế. Lượng hữu hiệu trong việc diệt sinh vật gây hại của chế phẩm cũng sẽ thay đổi tùy theo các điều kiện thông dụng như tác dụng và khoảng thời gian diệt sinh vật gây hại mong muốn, thời tiết, loài đích nhắm đến, nơi ở, phương thức áp dụng, và các điều kiện tương tự.

Trong trường hợp xử lý đất, khi dùng lên luống trồng hoặc dùng lên nơi ở hoặc tổ của sinh vật gây hại, lượng thành phần hoạt tính nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 500g trên 100m², tốt hơn từ 0,001 đến 20g trên 100m².

Để sử dụng trong xử lý cây trồng, ví dụ, bằng cách dùng lên lá, tỷ lệ dùng của thành phần hoạt tính theo sáng chế có thể nằm trong khoảng từ 0,0001g đến 4000g trên một hecta, ví dụ, từ 1g đến 2kg trên một hecta hoặc từ 1g đến 750g trên một hecta, tốt hơn từ 1g đến 100g trên một hecta, tốt hơn nữa từ 10g đến 50g trên một hecta, ví dụ từ 10 đến 20g trên một hecta, từ 20 đến 30g trên một hecta, từ 30 đến 40g trên một hecta, hoặc từ 40 đến 50g trên một hecta.

Hợp chất theo sáng chế đặc biệt thích hợp để sử dụng trong xử lý hạt để bảo vệ hạt tránh khỏi côn trùng gây hại, nhất là tránh khỏi côn trùng gây hại sống trong đất, và rễ và thân chồi của cây non tạo ra chống lại các loài gây hại trong đất và các côn trùng sống trên lá. Do đó, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt tránh khỏi côn trùng, nhất là côn trùng trong đất, và bảo vệ rễ và thân chồi của cây non tránh khỏi côn trùng, nhất là các côn trùng sống trong đất và trên lá, phương pháp này bao gồm bước xử lý hạt trước khi gieo và/hoặc sau khi cho nảy mầm trước bằng hợp chất theo sáng chế. Việc bảo vệ rễ và

thân chồi của cây non là được ưu tiên. Được ưu tiên hơn nữa là việc bảo vệ thân chồi của cây non tránh khỏi côn trùng châm chích và hút, côn trùng nhai và giun tròn.

Thuật ngữ “xử lý hạt” bao gồm tất cả các kỹ thuật xử lý hạt thích hợp đã biết trong lĩnh vực, như các phương pháp tạo áo hạt, phủ hạt, quét bụi lên hạt, ngâm hạt, tạo viên trên hạt, và áp dụng tại luống trồng. Ứng dụng xử lý hạt bằng hoạt chất tốt hơn được thực hiện bằng cách phun hoặc bằng cách quét bụi hạt trước khi gieo thực vật và trước khi thực vật nảy mầm.

Sáng chế cũng bao gồm hạt được bao bằng hoặc chứa hoạt chất. Thuật ngữ "được bao bằng và/hoặc chứa" thường có nghĩa là thành phần hoạt tính là phần lớn nhất trên bề mặt của sản phẩm nhân giống ở thời điểm sử dụng, mặc dù một phần lớn hơn hoặc nhỏ hơn của thành phần này có thể xâm nhập vào sản phẩm nhân giống này, tùy thuộc vào phương pháp sử dụng. Khi sản phẩm nhân giống đã nêu được trồng (trồng lại), nó có thể hấp thu thành phần hoạt tính này.

Ví dụ, hạt thích hợp là hạt ngũ cốc, cây ăn củ, cây lấy dầu, các loại rau, gia vị, cây cảnh, ví dụ, hạt lúa mì cứng và lúa mì khác, lúa mạch, yến mạch, lúa mạch đen, ngô (ngô chăn nuôi và ngô lấy đường / ngô ngọt và ngô ruộng), đậu tương, cây lấy dầu, rau họ cải, bông, hướng dương, chuối, cây lúa, hạt cải dầu, cải ngọt, củ cải đường, củ cải dùng trong chăn nuôi, cà, khoai tây, củ, bắp củ, măng củ, củ dùng trong chăn nuôi, cà chua, tỏi tây, bí ngô/bí, rau cải, rau diếp băng, hạt tiêu, dưa chuột, dưa, các loài họ cải bắp, dưa, đậu, đậu Hà Lan, tỏi, hành, cà rốt, thực vật lấy củ như khoai tây, mía đường, thuốc lá, nho, dã yên thảo, phong lữ/quỳ thiên trúc, păng - xê và cây bóng nước.

Ngoài ra, hoạt chất cũng có thể được sử dụng để xử lý hạt từ thực vật mà đã được làm biến đổi bằng cách gây đột biến hoặc công nghệ di truyền, và ví dụ, thực vật này chịu được sự tác động của các chất diệt cỏ hoặc chất diệt nấm hoặc chất diệt côn trùng. Thực vật biến đổi như vậy đã được mô tả chi tiết ở trên.

Chế phẩm xử lý hạt thông thường bao gồm ví dụ, dịch cô đặc có thể chảy được FS, dung dịch LS, nhũ huyền phù (SE), bột để xử lý khô DS, bột phân tán trong nước để xử lý ở dạng huyền phù đặc WS, bột hòa tan trong nước SS và nhũ tương ES và EC và chế phẩm gel GF. Các chế phẩm này có thể được dùng cho hạt ở dạng đã pha loãng hoặc chưa được

pha loãng. Việc dùng cho hạt được thực hiện trước khi gieo hạt, hoặc trực tiếp lên trên hạt hoặc sau khi được làm nảy mầm sơ bộ. Tốt hơn chế phẩm được áp dụng sao cho, sự nảy mầm chưa được diễn ra.

Nồng độ hoạt chất trong chế phẩm sẵn sàng để sử dụng, có thể thu được sau khi pha loãng từ 2 đến 10 lần, tốt hơn nằm trong khoảng từ 0,01 đến 60% khối lượng, tốt hơn nữa từ 0,1 đến 40% khối lượng.

Theo một phương án được ưu tiên, chế phẩm FS được sử dụng để xử lý hạt. Điển hình, chế phẩm FS có thể chứa 1-800 g/l thành phần hoạt tính, 1-200 g/l chất hoạt động bề mặt, 0 đến 200 g/l chất chống đóng băng, 0 đến 400 g/l chất kết dính, 0 đến 200 g/l chất màu và lên tới 1 lít dung môi, tốt hơn là nước.

Chế phẩm FS đặc biệt được ưu tiên chứa hợp chất theo sáng chế để xử lý hạt thông thường chứa từ 0,1 đến 80% khối lượng (1 đến 800 g/l) thành phần hoạt tính, từ 0,1 đến 20% khối lượng (1 đến 200 g/l) ít nhất một chất hoạt động bề mặt, ví dụ, 0,05 đến 5% khối lượng chất thấm ướt và từ 0,5 đến 15% khối lượng chất phân tán, tới 20% khối lượng, ví dụ, từ 5 đến 20% chất chống đóng băng, từ 0 đến 15% khối lượng, ví dụ, 1 đến 15% khối lượng chất màu và/hoặc thuốc nhuộm, từ 0 đến 40% khối lượng, ví dụ, 1 đến 40% khối lượng chất kết dính (chất dính/chất bám dính), tùy ý lên tới 5% khối lượng, ví dụ, từ 0,1 đến 5% khối lượng chất làm đặc, tùy ý từ 0,1 đến 2% chất chống tạo bọt, và tùy ý chất bảo quản như chất diệt khuẩn, chất chống oxy hóa hoặc tương tự, ví dụ, với lượng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1% khối lượng và chất độn/thể mang lên tới 100% khối lượng.

Trong xử lý hạt, tỷ lệ dùng của hợp chất theo sáng chế thông thường nằm trong khoảng từ 0,1 g đến 10 kg trên 100 kg hạt, tốt hơn từ 1 g đến 5 kg trên 100 kg hạt, tốt hơn nữa từ 1 g đến 1000 g trên 100 kg hạt và tốt nhất từ 1 g đến 200 g trên 100 kg hạt, ví dụ, từ 1 g đến 100 g hoặc từ 5 g đến 100 g trên 100 kg hạt.

Do đó, sáng chế cũng đề cập đến hạt chứa hợp chất theo sáng chế, hoặc muối hữu dụng trong nông nghiệp của nó, như được xác định ở đây. Lượng hợp chất theo sáng chế hoặc muối hữu dụng trong nông nghiệp của nó thông thường thay đổi nằm trong khoảng từ 0,1 g đến 10 kg trên 100 kg hạt, tốt hơn từ 1 g đến 5 kg trên 100 kg hạt, tốt nhất từ 1 g

đến 1000 g trên 100 kg hạt. Đối với các cây trồng đặc biệt như rau diếp, tỷ lệ này có thể cao hơn.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng để cải thiện sức khỏe của thực vật. Do đó, sáng chế cũng đề cập đến phương pháp để cải thiện sức khỏe của thực vật bằng cách xử lý thực vật, vật liệu nhân giống thực vật và/hoặc địa điểm nơi mà thực vật đang sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng bằng một lượng hiệu quả và không gây độc cho thực vật của hợp chất theo sáng chế.

Theo sử dụng ở đây, “lượng hữu hiệu và không gây độc cho thực vật” có nghĩa là hợp chất được sử dụng với lượng cho phép đạt được tác dụng mong muốn nhưng không làm nảy sinh bất kỳ triệu chứng độc tính đối với thực vật ở thực vật được xử lý hoặc ở thực vật phát triển từ cành giâm đã xử lý hoặc đất đã xử lý.

Thuật ngữ “thực vật” và “vật liệu nhân giống thực vật” được xác định như ở trên.

“Sức khỏe của thực vật” được định nghĩa là tình trạng của thực vật và/hoặc các sản phẩm của nó mà được xác định thông qua nhiều khía cạnh riêng biệt hoặc kết hợp với nhau như năng suất (ví dụ, sinh khối tăng và/hoặc hàm lượng các thành phần có giá trị tăng), chất lượng (ví dụ, hàm lượng hoặc thành phần của các thành phần nhất định hoặc tuổi thọ cải thiện), sức sống của thực vật (ví dụ, sự sinh trưởng của thực vật được cải thiện và/hoặc lá xanh hơn (“tác dụng làm xanh lá”), chịu được áp lực phi sinh học (ví dụ, hạn hán) và/hoặc áp lực sinh học (ví dụ, bệnh) và hiệu quả sản xuất (ví dụ, hiệu quả thu hoạch, khả năng chế biến).

Các chỉ dấu xác định ở trên về tình trạng sức khỏe của thực vật có thể phụ thuộc lẫn nhau và có thể được sinh ra từ nhau. Mỗi một chỉ dấu được xác định trong lĩnh vực và có thể được xác định bằng cách phương pháp đã biết đối với người có kỹ năng trong lĩnh vực.

Hợp chất theo sáng chế cũng thích hợp để sử dụng chống lại côn trùng gây hại không phải cho cây trồng. Để sử dụng chống lại các loài không gây hại cho cây trồng, hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng ở dạng chế phẩm bả, gel, các ứng dụng phun côn trùng chung, sol khí, ở dạng ứng dụng thể tích cực thấp và giường màn (tắm hoặc áp dụng trên bề mặt). Ngoài ra, phương pháp tưới ướt và chọc lỗ có thể được sử dụng.

Như được sử dụng trong bản mô tả này, thuật ngữ “các loài không gây hại cho cây trồng” để chỉ các loài gây hại mà đặc biệt thích hợp cho các mục đích không liên quan với cây trồng, như kiến, mối, ong bắp cày, ruồi, tích, muỗi, đê mèn hoặc gián.

Mỗi bả có thể là chế phẩm dạng lỏng, rắn hoặc bán rắn (chẳng hạn gel). Mỗi bả được dùng trong chế phẩm là sản phẩm, mà nó đủ hấp dẫn để khuyến khích côn trùng như kiến, mối, ong vò vẽ, ruồi, muỗi, đê v.v.. hoặc gián ăn chúng. Sự hấp dẫn có thể được điều chỉnh bằng cách sử dụng chất kích thích ăn hoặc pheromon giới tính. Chất kích thích ăn được chọn, ví dụ, nhưng không chỉ, từ protein động vật và/hoặc thực vật (thức ăn từ thịt, cá hoặc máu, các bộ phận của côn trùng, lòng đỏ trứng), từ chất béo và dầu có nguồn gốc động vật và/hoặc thực vật, hoặc mono-, oligo- hoặc polyorganosacarit, đặc biệt là từ sucroza, lactoza, fructoza, dextroza, glucoza, tinh bột, pectin hoặc thậm chí ri đường hoặc mật ong. Các phần tươi nguyên hoặc đang thối rữa của quả, cây trồng, thực vật, động vật, côn trùng hoặc các phần cụ thể của nó cũng có thể được dùng làm chất kích thích ăn. Pheromon giới tính được biết đến là đặc hiệu hơn đối với côn trùng. Các pheromon được mô tả trong tài liệu (ví dụ, <http://www.pherobase.com>), và đã biết đối với người có kỹ năng trong lĩnh vực.

Để sử dụng trong các chế phẩm bả, hàm lượng điển hình của thành phần hoạt tính nằm trong khoảng từ 0,001% khối lượng đến 15% khối lượng, tốt hơn từ 0,001% khối lượng đến 5% khối lượng hoạt chất.

Chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế ở dạng sol khí (ví dụ, trong các bình phun), phun dầu hoặc bơm phun là rất thích hợp cho người sử dụng không chuyên nghiệp trong phòng trừ các loài gây hại như ruồi, bọ chét, tích, muỗi hoặc dán. Thành phần sol khí tốt hơn bao gồm hoạt chất, dung môi, ngoài ra, các chất hỗ trợ như chất tạo nhũ tương, dầu thơm, nếu thích hợp các chất làm ổn định và nếu cần thiết thì cả các chất đẩy.

Chế phẩm phun dầu khác với công thức sol khí ở chỗ không sử dụng các tác nhân đẩy.

Để dùng trong chế phẩm phun, hàm lượng của thành phần hoạt tính là từ 0,001 đến 80% khối lượng, tốt hơn là từ 0,01 đến 50% khối lượng và tốt nhất là từ 0,01 đến 15% khối lượng.

Hợp chất theo sáng chế và chế phẩm tương ứng của nó cũng có thể được sử dụng trong các cuộn hương vòng khử muỗi, các hộp xông khói, các đĩa bay hơi hoặc các thiết bị làm bay hơi trong thời gian dài và cũng như trong giấy chống sâu nhậy, các miếng thấm chống nhậy hoặc các hệ thống bay hơi phụ thuộc nhiệt khác.

Phương pháp phòng trừ các bệnh lây truyền bởi côn trùng (chẳng hạn sốt rét, sốt xuất huyết và sốt vàng da, bệnh giun chỉ bạch huyết, và bệnh nhiệt đen) bằng hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm tương ứng của nó cũng bao gồm bước xử lý bề mặt của lều và nhà, phun không khí và tắm các rèm, lều, các vật dụng quần áo, màn, bẫy ruồi xê-xê hoặc các phương pháp tương tự. Chế phẩm trừ côn trùng để dùng cho xơ, vải, các sản phẩm đan, vải không dệt, vật liệu lưới hoặc nền và vải nhựa tốt hơn là chứa hỗn hợp gồm thuốc trừ côn trùng, tùy ý thuốc trừ rệp và ít nhất một chất kết dính.

Hợp chất theo sáng chế và chế phẩm chứa hợp chất này có thể được sử dụng để bảo vệ các vật liệu gỗ như cây, hàng rào ván ép, tà vẹt, các khung gỗ, các đồ tạo tác nghệ thuật, v.v.. và các tòa nhà, nhưng cũng cả cho vật liệu xây dựng, đồ đạc trong nhà, đồ da, xơ sợi, các vật dụng làm từ vinyl, dây điện và dây cáp .v.v. tránh khỏi kiến và/hoặc mối mọt, và để phòng trừ kiến và mối mọt không gây hại cho cây trồng hoặc con người (ví dụ, khi các loài gây hại xâm nhập vào nhà ở và các cơ sở công cộng).

Tỷ lệ dùng thông thường trong bảo vệ vật liệu là, ví dụ, nằm trong khoảng từ 0,001 g đến 2000 g hoặc từ 0,01 g đến 1000 g hoạt chất trên m² vật liệu xử lý, tốt hơn từ 0,1 g đến 50 g trên m².

Chế phẩm trừ côn trùng dùng để tắm cho các 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 thuốc trừ rệp và/hoặc thuốc trừ côn trùng.

Hợp chất theo sáng chế đặc biệt thích hợp trong phòng trừ hữu hiệu các động vật gây hại như động vật chân khớp, động vật chân bụng và giun tròn bao gồm nhưng không chỉ giới hạn bởi:

côn trùng thuộc bộ Cánh vẩy (Lepidoptera), ví dụ *Achroia grisella*, *Acleris* spp. như *A. fimbriana*, *A. gloverana*, *A. variana*; *Acrolepiopsis assectella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp. như *A. cyrtosema*, *A. orana*; *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. như *A.*

exclamationis, *A. fucosa*, *A. epsilon*, *A. orthogona*, *A. segetum*, *A. subterranea*; *Alabama argillacea*, *Aleurodicus dispersus*, *Alsophila pometaria*, *Ampelophaga rubiginosa*, *Amyelois transitella*, *Anacampsis sarcitella*, *Anagasta kuehniella*, *Anarsia lineatella*, *Anisota senatoria*, *Antheraea pernyi*, *Anticarsia* (= *Thermesia*) spp. như *A. gemmatilis*; *Apamea* spp., *Aproaerema modicella*, *Archips* spp. như *A. argyrospila*, *A. fuscocupreanus*, *A. rosana*, *A. xyloeanus*; *Argyresthia conjugella*, *Argyroploce* spp., *Argyrotaenia* spp. như *A. velutinana*; *Athetis mindara*, *Austroasca viridigrisea*, *Autographa gamma*, *Autographa nigrisigna*, *Barathra brassicae*, *Bedellia* spp., *Bonagota salubricola*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp. như *C. murinana*, *C. podana*; *Cactoblastis cactorum*, *Cadra cautella*, *Calingo braziliensis*, *Caloptilis theivora*, *Capua reticulana*, *Carposina* spp. như *C. niponensis*, *C. sasakii*; *Cephus* spp., *Chaetocnema aridula*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. như *C. Indicus*, *C. suppressalis*, *C. partellus*; *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp. như *C. conflictana*, *C. fumiferana*, *C. longicellana*, *C. murinana*, *C. occidentalis*, *C. rosaceana*; *Chrysodeixis* (= *Pseudoplusia*) spp. như *C. eriosoma*, *C. includens*; *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Cochylis hospes*, *Coleophora* spp., *Colias eurytheme*, *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Corcyra cephalonica*, *Crambus caliginosellus*, *Crambus teterrellus*, *Crociosema* (= *Epinotia*) *aporema*, *Cydalima* (= *Diaphania*) *perspectalis*, *Cydia* (= *Carpocapsa*) spp. như *C. pomonella*, *C. latiferreana*; *Dalaca noctuides*, *Datana integerrima*, *Dasychira pinicola*, *Dendrolimus* spp. như *D. pini*, *D. spectabilis*, *D. sibiricus*; *Desmia funeralis*, *Diaphania* spp. như *D. nitidalis*, *D. hyalinata*; *Diatraea grandiosella*, *Diatraea saccharalis*, *Diphthera festiva*, *Earias* spp. như *E. insulana*, *E. vittella*; *Ecdytolopha aurantiana*, *Egira* (= *Xylomyges*) *curialis*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Endopiza viteana*, *Ennomos subsignaria*, *Eoreuma loftini*, *Epehestia* spp. như *E. cautella*, *E. elutella*, *E. kuehniella*; *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erannis tiliaria*, *Erionota thrax*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Faronta albilinea*, *Feltia* spp. như *F. subterranean*; *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp. như *G. funebrana*, *G.*

molesta, *G. inopinata*; *Halysidota* spp., *Harrisina americana*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp. như *H. armigera* (= *Heliothis armigera*), *H. zea* (= *Heliothis zea*); *Heliothis* spp. như *H. assulta*, *H. subflexa*, *H. virescens*; *Hellula* spp. như *H. undalis*, *H. rogatalis*; *Helocoverpa gelotopoeon*, *Hemileuca oliviae*, *Herpetogramma licarsisalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma electellum*, *Homona magnanima*, *Hypena scabra*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Kakivoria flavofasciata*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria fiscellaria*, *Lambdina fiscellaria lugubrosa*, *Lamprosema indicata*, *Laspeyresia molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Lerodea eufala*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoma salicis*, *Leucoptera* spp. như *L. coffeella*, *L. scitella*; *Leuminivora lycinivorella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Llattia octo* (= *Amyna axis*), *Lobesia botrana*, *Lophocampa* spp., *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege* spp. như *L. sticticalis*, *L. cereralis*; *Lymantria* spp. như *L. dispar*, *L. monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Lyonetia prunifoliella*, *Malacosoma* spp. như *M. americanum*, *M. californicum*, *M. constrictum*, *M. neustria*; *Mamestra* spp. như *M. brassicae*, *M. configurata*; *Mamstra brassicae*, *Manduca* spp. như *M. quinquemaculata*, *M. sexta*; *Marasmia* spp., *Marmara* spp., *Maruca testulalis*, *Megalopyge lanata*, *Melanchra picta*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp. như *M. lapites*, *M. repanda*; *Mocis latipes*, *Monochroa fragariae*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacella*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nepytia* spp., *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omiodes indicata*, *Omphisa anastomosalis*, *Operophtera brumata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Orthaga thyrisalis*, *Ostrinia* spp. như *O. nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Paleacrita vernata*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Papaipema nebris*, *Papilio cresphontes*, *Paramyelois transitella*, *Paranthrene regalis*, *Paysandisia archon*, *Pectinophora* spp. như *P. gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Perileucoptera* spp., như *P. coffeella*; *Phalera bucephala*, *Phryganidia californica*, *Phthorimaea* spp. như *P. operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. như *P. blancardella*, *P. crataegella*, *P. issikii*, *P. ringoniella*; *Pieris* spp. như *P. brassicae*, *P. rapae*, *P. napi*; *Pilocrocis tripunctata*, *Plathypena scabra*, *Platynota* spp. như *P. flavedana*, *P. idaeusalis*, *P. stultana*; *Platyptilia carduidactyla*, *Plebejus argus*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Pontia*

protodica, *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Proxenus lepigone*, *Pseudaletia* spp. như *P. sequax*, *P. unipuncta*; *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Rhizobius ventralis*, *Rhyacionia frustrana*, *Sabulodes aegrotata*, *Schizura concinna*, *Schoenobius* spp., *Schreckensteinia festaliella*, *Scirpophaga* spp. như *S. incertulas*, *S. innotata*; *Scotia segetum*, *Sesamia* spp. như *S. inferens*, *Seudyra subflava*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spilonota lechriaspis*, *S. ocellana*, *Spodoptera* (= *Lamphygma*) spp. như *S. cosmoides*, *S. eridania*, *S. exigua*, *S. frugiperda*, *S. latisfascia*, *S. littoralis*, *S. litura*, *S. omithogalli*; *Stigmella* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Strymon bazochii*, *Sylepta derogata*, *Synanthedon* spp. như *S. exitiosa*, *Tecia solanivora*, *Telehin licus*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thaumatotibia* (= *Cryptophlebia*) *leucotreta*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thecla* spp., *Theresimima ampelophaga*, *Thyrintina* spp., *Tildenia inconspicuell*, *Tinea* spp. như *T. cloacella*, *T. pellionella*; *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp. như *T. viridana*; *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp. như *T. ni*; *Tuta* (= *Scrobipalpula*) *absoluta*, *Udea* spp. như *U. rubigalis*, *U. rubigalis*; *Virachola* spp., *Yponomeuta padella*, và *Zeiraphera canadensis*;

côn trùng thuộc bộ Cánh cứng (Coleoptera), ví dụ, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus* spp. như *A. anxius*, *A. planipennis*, *A. sinuatus*; *Agriotes* spp. như *A. fuscicollis*, *A. lineatus*, *A. obscurus*; *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anisoplia austriaca*, *Anobium punctatum*, *Anomala corpulenta*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. như *A. glabripennis*; *Anthonomus* spp. như *A. eugenii*, *A. grandis*, *A. pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. như *A. linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. như *B. lentis*, *B. pisorum*, *B. rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callidiellum rufipenne*, *Callopietria floridensis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cameraria ohridella*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorhynchus* spp. như *C. assimilis*, *C. napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. như *C. vespertinus*; *Conotrachelus nenuphar*, *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*,

Cryptorhynchus lapathi, *Ctenicera* spp. như *C. destructor*; *Curculio* spp., *Cylindrocopturus* spp., *xyclocephala* spp., *Dactylispa balyi*, *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. như *D. undecimpunctata*, *D. speciosa*, *D. longicornis*, *D. semipunctata*, *D. virgifera*; *Diaprepes abbreviates*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus abderus*, *Diocalandra frumenti* (*Diocalandra stigmaticollis*), *Enaphalodes rufulus*, *Epilachna* spp. như *E. varivestis*, *E. vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. như *E. hirtipennis*, *E. similaris*; *Eutheola humilis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera* spp. như *H. brunneipennis*, *H. postica*; *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp. như *L. bilineata*, *L. melanopus*; *Leptinotarsa* spp. như *L. decemlineata*; *Leptispa pygmaea*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lyctus* spp. như *L. bruneus*; *Liogenys fuscus*, *Macroductylus* spp. như *M. subspinosus*; *Maladera matrida*, *Megaplatypus mutates*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp. như *M. aeneus*; *Melolontha* spp. như *M. hippocastani*, *M. melolontha*; *Metamasius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Migdolus* spp. như *M. fryanus*, *Monochamus* spp. như *M. alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oberia brevis*, *Oemona hirta*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon* spp. như *P. brassicae*, *P. cochleariae*; *Phoracantha recurva*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp. như *P. helleri*; *Phyllotreta* spp. như *P. chrysocephala*, *P. nemorum*, *P. striolata*, *P. vittula*; *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psacotha hilaris*, *Psylliodes chrysocephala*, *Prostephanus truncates*, *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Pulga saltona*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp. như *R. billineatus*, *R. ferrugineus*, *R. palmarum*, *R. phoenicis*, *R. vulneratus*; *Saperda candida*, *Scolytus schevyrewi*, *Scyphophorus acupunctatus*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. như *S. granaria*, *S. oryzae*, *S. zeamais*; *Sphenophorus* spp. như *S. levis*; *Stegobium paniceum*, *Sternechus*

spp. như *S. subsignatus*; *Strophomorphus ctenotus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp. như *T. castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp. như *X. pyrrhoderus*; và, *Zabrus* spp. như *Z. tenebrioides*;

côn trùng thuộc bộ Hai cánh (Diptera) ví dụ *Aedes* spp. như *A. aegypti*, *A. albopictus*, *A. vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. như *A. albimanus*, *A. crucians*, *A. freeborni*, *A. gambiae*, *A. leucosphyrus*, *A. maculipennis*, *A. minimus*, *A. quadrimaculatus*, *A. sinensis*; *Bactrocera invadens*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp. như *C. bezziana*, *C. hominivorax*, *C. macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. như *C. hominivorax*; *Contarinia* spp. như *C. sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. như *C. nigripalpus*, *C. pipiens*, *C. quinquefasciatus*, *C. tarsalis*, *C. tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Dasineura oxycoccana*, *Delia* spp. như *D. antique*, *D. coarctata*, *D. platura*, *D. radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp. như *D. suzukii*, *Fannia* spp. như *F. canicularis*; *Gastrophilus* spp. như *G. intestinalis*; *Geomyza tipunctata*, *Glossina* spp. như *G. fuscipes*, *G. morsitans*, *G. palpalis*, *G. tachinoides*; *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. như *H. platura*; *Hypoderma* spp. như *H. lineata*; *Hyppobosca* spp., *Hydrellia philippina*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. như *L. sativae*, *L. trifolii*; *Lucilia* spp. như *L. caprina*, *L. cuprina*, *L. sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola* spp. như *M. destructor*; *Musca* spp. như *M. autumnalis*, *M. domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. như *O. ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. như *O. frit*; *Orseolia oryzae*, *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. như *P. antiqua*, *P. brassicae*, *P. coarctata*; *Phytomyza gymnostoma*, *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis* spp. như *R. cerasi*, *R. cingulate*, *R. indifferens*, *R. mendax*, *R. pomonella*; *Rivellia quadrifasciata*, *Sarcophaga* spp. như *S. haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Sitodiplosis mosellana*, *Stomoxys* spp. như *S.*

calcitrans; *Tabanus* spp. như *T. atratus*, *T. bovinus*, *T. lineola*, *T. similis*; *Tannia* spp., *Thecodiplosis japonensis*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, và *Wohlfahrtia* spp;

côn trùng thuộc bộ Cánh viền (Thysanoptera) ví dụ, *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* spp., *Echinothrips americanus*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. như *F. fusca*, *F. occidentalis*, *F. tritici*; *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Microcephalothrips abdominalis*, *Neohydatothrips samayunkur*, *Pezothrips kellyanus*, *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. như *S. citri*, *S. dorsalis*, *S. perseae*; *Stenchaetothrips* spp, *Taeniothrips cardamoni*, *Taeniothrips inconsequens*, *Thrips* spp. như *T. imagines*, *T. hawaiiensis*, *T. oryzae*, *T. palmi*, *T. parvispinus*, *T. tabaci*;

côn trùng thuộc bộ cánh nửa (Hemiptera) ví dụ., *Acizzia jamatonica*, *Acrosternum* spp. như *A. hilare*; *Acyrtosipon* spp. như *A. onobrychis*, *A. pisum*; *Adelges laricis*, *Adelges tsugae*, *Adelphocoris* spp., như *A. rapidus*, *A. superbus*; *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aulacorthum solani*, *Aleurocanthus woglumi*, *Aleurodes* spp., *Aleurodicus disperses*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. như *A. craccivora*, *A. fabae*, *A. forbesi*, *A. gossypii*, *A. grossulariae*, *A. maidiradicis*, *A. pomi*, *A. sambuci*, *A. schneideri*, *A. spiraeicola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacaspis yasumatsui*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli* (*Paratrioza cockerelli*), *Bemisia* spp. như *B. argentifolii*, *B. tabaci* (*Aleurodes tabaci*); *Blissus* spp. như *B. leucopterus*; *Brachycaudus* spp. như *B. cardui*, *B. helichrysi*, *B. persicae*, *B. prunicola*; *Brachycolus* spp., *Brachycorynella asparagi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp. như *C. fulguralis*, *C. pyricola* (*Psylla piri*); *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Ceroplastes ceriferus*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp. như *C. hemipterus*, *C. lectularius*; *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp. như *C. hesperidum*, *C. pseudomagnoliarum*; *Corythucha*

arcuata, *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Chrysomphalus aonidum*, *Cryptomyzus ribis*, *Ctenarytaina spatulata*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurodes* spp. như *D. citrifolii*; *Dalbulus maidis*, *Diaphorina* spp. như *D. citri*; *Diaspis* spp. như *D. bromeliae*; *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. như *D. plantaginea*, *D. pyri*, *D. radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. như *D. cingulatus*, *D. intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Edessa* spp., *Geocoris* spp., *Empoasca* spp. như *E. fabae*, *E. solana*; *Epidiaspis leperii*, *Eriosoma* spp. như *E. lanigerum*, *E. pyricola*; *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. như *E. integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. như *E. heros*, *E. impictiventris*, *E. servus*; *Fiorinia theae*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis brimblecombei*, *Halyomorpha* spp. như *H. halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca vitripennis* (= *H. coagulata*), *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp. như *I. purchasi*; *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lecanoideus floccissimus*, *Lepidosaphes* spp. như *L. ulmi*; *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp. như *L. hesperus*, *L. lineolaris*, *L. pratensis*; *Maconellicoccus hirsutus*, *Marchalina hellenica*, *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. như *M. rosae*, *M. avenae*, *M. euphorbiae*; *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraeae*, *Melanaphis sacchari*, *Melanocallis* (= *Tinocallis*) *caryaefoliae*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzocallis coryli*, *Murgantia* spp., *Myzus* spp. như *M. ascalonicus*, *M. cerasi*, *M. nicotianae*, *M. persicae*, *M. varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Neotoxoptera formosana*, *Neomegalotomus* spp., *Nephotettix* spp. như *N. malayanus*, *N. nigropictus*, *N. parvus*, *N. virescens*; *Nezara* spp. như *N. viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Nysius huttoni*, *Oebalus* spp. như *O. pugnax*; *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Parabemisia myricae*, *Parlatoria* spp., *Parthenolecanium* spp. như *P. corni*, *P. persicae*; *Pemphigus* spp. như *P. bursarius*, *P. populiveneris*; *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp. như *P. aceris*, *P. gossypii*; *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp. như *P. devastatrix*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp. như *P. guildinii*; *Pinnaspis aspidistrae*,

Planococcus spp. như *P. citri*, *P. ficus*; *Prosapia bicincta*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. như *P. comstocki*; *Psylla* spp. như *P. mali*; *Pteromalus* spp., *Pulvinaria amygdali*, *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., như *Q. perniciosus*; *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhizoecus americanus*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. như *R. pseudobrassicarum*, *R. insertum*, *R. maidis*, *R. padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaptocoris* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Spissistilus festinus* (= *Stictocephala festina*), *Stephanitis nashi*, *Stephanitis pyrioides*, *Stephanitis takeyai*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetraleurodes perseae*, *Therioaphis maculate*, *Thyanta* spp. như *T. accerra*, *T. perditor*; *Tibraca* spp., *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp. như *T. aurantii*; *Trialeurodes* spp. như *T. abutilonea*, *T. ricini*, *T. vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. như *U. citri*, *U. yanonensis*; và *Viteus vitifolii*,

côn trùng thuộc bộ Cánh màng (Hymenoptera) ví dụ *Acanthomyops interjectus*, *Athalia rosae*, *Atta* spp. như *A. capiguara*, *A. cephalotes*, *A. cephalotes*, *A. laevigata*, *A. robusta*, *A. sexdens*, *A. texana*, *Bombus* spp., *Brachymyrmex* spp., *Camponotus* spp. như *C. floridanus*, *C. pennsylvanicus*, *C. modoc*; *Cardiocondyla nuda*, *Chalibion* sp, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Dorymyrmex* spp., *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica* spp., *Hoplocampa* spp. như *H. minuta*, *H. testudinea*; *Iridomyrmex humilis*, *Lasius* spp. như *L. niger*, *Linepithema humile*, *Liometopum* spp., *Leptocybe invasa*, *Monomorium* spp. như *M. pharaonis*, *Monomorium*, *Nylandria fulva*, *Pachycondyla chinensis*, *Paratrechina longicornis*, *Paravespula* spp., như *P. germanica*, *P. pennsylvanica*, *P. vulgaris*; *Pheidole* spp. như *P. megacephala*; *Pogonomyrmex* spp. như *P. barbatus*, *P. californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Prenolepis imparis*, *Pseudomyrmex gracilis*, *Schelipron* spp., *Sirex cyaneus*, *Solenopsis* spp. như *S. geminata*, *S. invicta*, *S. molesta*, *S. richteri*, *S. xyloni*, *Sphecius speciosus*, *Sphex* spp., *Tapinoma* spp. như *T. melanocephalum*, *T. sessile*; *Tetramorium* spp. như *T. caespitum*, *T.*

bicarinatum, *Vespa* spp. như *V. crabro*; *Vespula* spp. như *V. squamosa*; *Wasmannia auropunctata*, *Xylocopa* sp;

côn trùng thuộc bộ Cánh thẳng (Orthoptera), ví dụ, *Acheta domesticus*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Ceuthophilus* spp., *Diastrammena asynamora*, *Dociostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa* spp. như *G. africana*, *G. gryllotalpa*; *Gryllus* spp., *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta* spp. như *L. migratoria*, *L. pardalina*; *Melanoplus* spp. như *M. bivittatus*, *M. femurrubrum*, *M. mexicanus*, *M. sanguinipes*, *M. spretus*; *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Scapteriscus* spp., *Schistocerca* spp. như *S. americana*, *S. gregaria*, *Stemopelmatus* spp., *Tachycines asynamorus*, và *Zonozerus variegatus*;

sinh vật gây hại từ lớp nhện (Arachnida), ví dụ, Acari, ví dụ, thuộc các họ Argasidae, Ixodidae và Sarcoptidae, như *Amblyomma* spp. (ví dụ, *A. americanum*, *A. variegatum*, *A. maculatum*), Argas spp. như *A. persicu*), *Boophilus* spp. như *B. annulatus*, *B. decoloratus*, *B. microplus*, *Dermacentor* spp. như *D. silvarum*, *D. andersoni*, *D. variabilis*, *Hyalomma* spp. như *H. truncatum*, *Ixodes* spp. như *I. ricinus*, *I. rubicundus*, *I. scapularis*, *I. holocyclus*, *I. pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Ornithodoros* spp. như *O. moubata*, *O. hermsi*, *O. turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. như *P. ovis*, *Rhipicephalus* spp. như *R. sanguineus*, *R. appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. như *S. Scabiei*; và họ lông nhung (Eriophyidae) gồm *Aceria* spp. như *A. sheldoni*, *A. anthocoptes*, *Acallitus* spp., *Aculops* spp. như *A. lycopersici*, *A. pelekassi*; *Aculus* spp. như *A. schlechtendali*; *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Phyllocoptruta oleivora*; *Eriophytes ribis* và *Eriophyes* spp. như *Eriophyes sheldoni*; họ nhện gié (Tarsonemidae) gồm *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* và *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp. *Steneotarsonemus spinki*; họ Tenuipalpidae gồm *Brevipalpus* spp. như *B. phoenicis*; họ Tetranychidae gồm *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Petrobia latens*, *Tetranychus* spp. như *T. cinnabarinus*, *T. evansi*, *T. kanzawai*, *T. pacificus*, *T. phaseolus*, *T. telarius* và *T. urticae*; *Bryobia praetiosa*; *Panonychus* spp. như *P. ulmi*, *P. citri*; *Metatetranychus* spp. và *Oligonychus* spp. như *O. pratensis*, *O. perseae*, *Vasates lycopersici*; *Raoiella indica*,

họCarpoglyphidae gồm *Carpoglyphus* spp.; *Penthaleidae* spp. như *Halotydeus destructor*; họDemodicidae với các loài như *Demodex* spp.; họ Trombicidea gồm *Trombicula* spp.; họ Macronyssidae gồm *Ornithonyssus* spp.; họ Pyemotidae gồm *Pyemotes tritici*; *Tyrophagus putrescentiae*; họ Acaridae gồm *Acarus siro*; họAraneida gồm *Latrodectus mactans*, *Tegenaria agrestis*, *Chiracanthium* sp, *Lycosa* sp *Achaeearanea tepidariorum* và *Loxosceles reclusa*;

sinh vật gây hại thuộc ngành giun tròn (Nematoda), ví dụ, giun tròn ký sinh trên thực vật như giun tròn gây sần rễ, *Meloidogyne* spp. như *M. hapla*, *M. incognita*, *M. javanica*; giun tròn tạo nang, *Globodera* spp. như *G. rostochiensis*; *Heterodera* spp. như *H. avenae*, *H. glycines*, *H. schachtii*, *H. trifolii*; Giun tròn gây nốt sần hạt, *Anguina* spp.; giun tròn trên cuống và lá, *Aphelenchoides* spp. như *A. besseyi*; giun tròn có vôi, *Belonolaimus* spp. như *B. longicaudatus*; giun tròn trên thông, *Bursaphelenchus* spp. như *B. lignicolus*, *B. xylophilus*; giun tròn vòng, *Criconema* spp., *Criconemella* spp. như *C. xenoplax* và *C. ornata*; và *Criconemoides* spp. như *Criconemoides informis*; *Mesocriconema* spp.; giun tròn trên thân và hành, *Ditylenchus* spp. như *D. destructor*, *D. dipsaci*; giun tròn dạng dùi, *Dolichodorus* spp.; giun tròn xoắn, *Heliocotylenchus multicinctus*; giun tròn có vỏ và dạng vỏ cứng, *Hemicycliophora* spp. và *Hemicriconemoides* spp.; *Hirshmanniella* spp.; giun tròn dạng móc, *Hoploaimus* spp.; giun tròn giả sần rễ, *Nacobbus* spp.; giun tròn dạng kim, *Longidorus* spp. như *L. elongatus*; giun tròn gây tổn thương, *Pratylenchus* spp. như *P. brachyurus*, *P. neglectus*, *P. penetrans*, *P. curvatus*, *P. goodeyi*; giun tròn đào hang, *Radopholus* spp. như *R. similis*; *Rhadopholus* spp.; *Rhodopholus* spp.; giun tròn dạng thận, *Rotylenchus* spp. như *R. robustus*, *R. reniformis*; *Scutellonema* spp.; giun tròn gây ngứa rễ, *Trichodorus* spp. như *T. obtusus*, *T. primitivus*; *Paratrichodorus* spp. như *P. minor*; giun tròn làm cây còi cọc, *Tylenchorhynchus* spp. như *T. claytoni*, *T. dubius*; giun tròn ở cam quýt, *Tylenchulus* spp. như *T. semipenetrans*; giun tròn hình đoạn kiếm, *Xiphinema* spp.; và các loài giun tròn khác ký sinh trên thực vật;

côn trùng thuộc bộ Mối (Isoptera) ví dụ, *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes* spp. như *C. formosanus*, *C. gestroi*, *C. acinaciformis*; *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes*

spp. như *C. brevis*, *C. cavifrons*; *Globitermes sulfureus*, *Heterotermes* spp. như *H. aureus*, *H. longiceps*, *H. tenuis*; *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Incisitermes* spp. như *I. minor*, *I. Snyder*; *Marginitermes hubbardi*, *Mastotermes* spp. như *M. darwiniensis* *Neocapritermes* spp. như *N. opacus*, *N. parvus*; *Neotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Zootermopsis* spp. như *Z. angusticollis*, *Z. nevadensis*, *Reticulitermes* spp. như *R. hesperus*, *R. tibialis*, *R. speratus*, *R. flavipes*, *R. grassei*, *R. lucifugus*, *R. santonensis*, *R. virginicus*; *Termes natalensis*,

côn trùng thuộc bộ gián (Blattaria) ví dụ, *Blatta* spp. như *B. orientalis*, *B. lateralis*; *Blattella* spp. như *B. asahinae*, *B. germanica*; *Leucophaea maderae*, *Panchlora nivea*, *Periplaneta* spp. như *P. americana*, *P. australasiae*, *P. brunnea*, *P. fuliginosa*, *P. japonica*; *Supella longipalpa*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Eurycotis floridana*, *Pycnoscelus surinamensis*,

côn trùng thuộc bộ Bọ chét (Siphonoptera) ví dụ *Cediopsylla simplex*, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides felis* spp. như *C. felis*, *C. canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Trichodectes canis*, *Tunga penetrans*, và *Nosopsyllus fasciatus*,

côn trùng thuộc bộ Ba đuôi (Thysanura) ví dụ *Lepisma saccharina*, *Ctenolepisma urbana*, và *Thermobia domestica*,

sinh vật gây hại thuộc lớp chân môi (Chilopoda), ví dụ, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. như *Scutigera coleoptrata*;

sinh vật gây hại thuộc lớp chân kép (Diplopoda), ví dụ, *Blaniulus guttulatus*, *Julus* spp., *Narceus* spp.,

sinh vật gây hại thuộc lớp Rết tơ (Symphyla) ví dụ, *Scutigera immaculata*,

côn trùng thuộc bộ cánh da (Dermaptera), ví dụ, *Forficula auricularia*,

côn trùng thuộc bộ Đuôi bật (Collembola), ví dụ, *Onychiurus* spp., như *Onychiurus armatus*,

sinh vật gây hại thuộc bộ Chân đều (Isopoda) ví dụ, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*,

côn trùng thuộc bộ Chấy rận (Phthiraptera), ví dụ, *Damalinia* spp., *Pediculus* spp. như *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pediculus humanus*

humanus; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. như *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. như *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* và *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,

Ví dụ về các loài sinh vật gây hại khác mà có thể được phòng trừ bằng hợp chất có công thức (I) bao gồm: sinh vật gây hại thuộc ngành thân mềm (Mollusca), lớp hai mảnh vỏ (Bivalvia), ví dụ, *Dreissena* spp.; lớp chân bụng (Gastropoda), ví dụ, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea canaliculata*, *Succinea* spp.; từ lớp giun sán, ví dụ, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp. như *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostromylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Hợp chất theo sáng chế thích hợp để sử dụng trong xử lý hoặc bảo vệ động vật chống lại sự gây hại hoặc lây nhiễm bởi vật ký sinh. Do đó, sáng chế cũng đề cập đến việc sử dụng hợp chất theo sáng chế trong sản xuất thuốc để xử lý hoặc bảo vệ động vật chống lại sự gây hại hoặc lây nhiễm bởi vật ký sinh. Ngoài ra, sáng chế còn đề xuất phương pháp xử lý hoặc bảo vệ động vật chống lại sự gây hại và lây nhiễm bởi vật ký sinh, phương pháp này bao gồm việc sử dụng theo đường miệng, sử dụng tại chỗ hoặc sử dụng ngoài đường ngoài tiêu hóa hoặc áp dụng cho động vật một lượng hữu hiệu diệt vật ký sinh của hợp chất theo sáng chế.

Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng phi điều trị của hợp chất theo sáng chế để xử lý hoặc bảo vệ động vật chống lại sự gây hại và lây nhiễm bởi vật ký sinh. Ngoài ra, sáng chế

còn đề xuất phương pháp phi điều trị để xử lý hoặc bảo vệ động vật chống lại sự gây hại và lây nhiễm bởi vật ký sinh, phương pháp này bao gồm bước đưa lên nơi ở một lượng hữu hiệu diệt vật ký sinh của hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế cũng thích hợp để sử dụng để chống lại hoặc phòng trừ vật ký sinh ở trong và trên động vật. Ngoài ra, sáng chế đề xuất phương pháp chống lại hoặc phòng trừ ký sinh trùng ở trong và trên động vật, phương pháp này bao gồm bước cho ký sinh trùng tiếp xúc với lượng hữu hiệu diệt ký sinh trùng của hợp chất theo sáng chế.

Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng phi điều trị của hợp chất theo sáng chế để chống lại hoặc phòng trừ vật ký sinh. Ngoài ra, sáng chế đề xuất phương pháp phi điều trị để chống lại hoặc phòng trừ vật ký sinh, phương pháp bao gồm bước đưa lên nơi ở một lượng hữu hiệu diệt vật ký sinh của hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế có thể có hiệu quả thông qua cả con đường tiếp xúc (thông qua đất, thủy tinh, vách, giường màn, thảm, chăn hoặc các bộ phận của động vật) và con đường tiêu hóa (ví dụ, mồi bả). Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng ở giai đoạn phát triển bất kỳ và tất cả các giai đoạn phát triển.

Hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng ở dạng nguyên như vậy hoặc ở dạng chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được áp dụng cùng với thành phần kết hợp, thành phần này hoạt động chống lại vật ký sinh gây bệnh, ví dụ, cùng với các hợp chất chống cầu trùng tổng hợp, kháng sinh polyete như Amprolium, Robenidin, Toltrazuril, Monensin, Salinomycin, Maduramicin, Lasalocid, Narasin hoặc Semduramicin, hoặc với các thành phần kết hợp khác như được xác định ở trên hoặc ở dạng chế phẩm chứa các hỗn hợp này.

Hợp chất theo sáng chế và chế phẩm chứa hợp chất này có thể được áp dụng theo đường miệng, theo đường ngoài tiêu hóa hoặc đường tại chỗ, ví dụ, theo đường da. Hợp chất theo sáng chế có thể có tác dụng theo đường toàn thân hoặc không toàn thân.

Việc dùng có thể được thực hiện theo kiểu phòng ngừa, trị liệu hoặc phi điều trị. Ngoài ra, việc áp dụng có thể được thực hiện theo cách dự phòng lên các vị trí mà kỳ vọng vật ký sinh sẽ xuất hiện ở đó.

Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ "tiếp xúc" bao gồm cả tiếp xúc trực tiếp (áp dụng hợp chất/chế phẩm trực tiếp lên vật ký sinh, bao gồm cả áp dụng trực tiếp lên động vật hoặc ngoại trừ việc áp dụng trực tiếp lên động vật, ví dụ, tại nơi ở của nó đối với trường hợp nêu sau) và tiếp xúc gián tiếp (áp dụng hợp chất/chế phẩm lên nơi ở của vật ký sinh). Việc cho vật ký sinh tiếp xúc thông qua việc sử dụng tại nơi ở của nó là ví dụ về việc sử dụng phi điều trị hợp chất theo sáng chế.

Thuật ngữ "nơi ở" có nghĩa là nơi sống, nguồn cung cấp thực phẩm, nơi sinh sản, khu vực, vật liệu hoặc môi trường mà ở đó, loài ký sinh đang sinh trưởng hoặc có thể sinh trưởng bên ngoài động vật.

Theo sử dụng ở đây, thuật ngữ "vật ký sinh" bao gồm vật nội ký sinh và ngoại ký sinh. Theo một số phương án của sáng chế, vật nội ký sinh có thể được ưu tiên. Theo các phương án khác, vật ngoại ký sinh có thể được ưu tiên. Sự phá hoại ở động vật máu nóng và cá bao gồm, nhưng không giới hạn ở, rận, chấy, ve, ấu trùng nhặng trong mũi, mòng, ruồi cắn, ruồi muscoid, ruồi, ấu trùng ruồi myiasitic, ấu trùng ve bét, muỗi mắt, muỗi và bọ chét.

Hợp chất theo sáng chế là đặc biệt hữu hiệu để chống lại loài ký sinh tương ứng thuộc các bộ và loài sau đây:

bọ chét (Siphonaptera), ví dụ, *Ctenocephalogenus felis*, *Ctenocephalogenus canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, và *Nosopsyllus fasciatus*; gián (Blattaria - Blattodea), ví dụ, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, và *Blatta orientalis*; ruồi, muỗi (Diptera), 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*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia*

hominis, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, và *Tabanus similis*; chấy rận (Phthiraptera), ví dụ, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus straminus* và *Solenopotes capillatus*; ve và bét ký sinh (Parasitiformes): ve (Ixodida), ví dụ, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* và bét ký sinh (Mesostigmata), ví dụ, *Ornithonyssus bacoti* và *Dermanyssus gallinae*; Actinedida (Prostigmata) và Acaridida (Astigmata), ví dụ, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., và *Laminosioptes* spp.; rệp (Heteropterida): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp., và *Arilus critatus*; Anoplurida, ví dụ, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp., và *Solenopotes* spp.; Mallophagida (phân bộ Amblycerina và Ischnocerina), ví dụ, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., và *Felicola* spp.; giun tròn Nematoda: 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 *Diocotophyma renale*; giun tròn trong 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* (giun guinea); Spirurida, ví dụ, *Thelazia* spp., *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerc* lupi, và *Habronema* spp.; giun đầu gai (Acanthocephala), ví dụ, *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* và *Oncicola* spp.; Planarians (Plathelminthes): Sán lá (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 bộ Sán dây (Tapeworms), ví dụ, *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocetoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., và *Hymenolepis* spp..

Như được sử dụng ở đây, thuật ngữ “động vật” bao gồm động vật máu nóng (bao gồm cả người) và cá. Được ưu tiên là động vật có vú, như gia súc, cừu, lợn, lạc đà, hươu, ngựa, lợn, gia cầm, thỏ, dê, chó và mèo, hà mã, lừa, đười ươi và tuần lộc, và cũng ở động vật có lông như chồn, sóc Bắc Mỹ và gấu trúc Bắc Mỹ, chim như gà mái, ngỗng, gà tây và vịt và cá như cá nước ngọt và nước mặn như cá hồi, cá chép và cá chình. Đặc biệt được ưu tiên là động vật nuôi trong gia đình, như chó hoặc mèo.

Thông thường, "lượng hữu hiệu diệt vật ký sinh" có nghĩa lượng thành phần hoạt tính cần để đạt được tác dụng có thể nhìn thấy được đối với sự sinh trưởng, bao gồm tác dụng hoại tử, chết, trì hoãn, phòng ngừa, và loại bỏ, tiêu diệt, hoặc làm giảm bớt theo cách khác sự xuất hiện và hoạt tính của sinh vật đích. lượng hữu hiệu diệt vật ký sinh có thể thay

đổi đối với hợp chất/chế phẩm khác nhau được sử dụng theo sáng chế. Lượng hữu hiệu trong việc diệt vật ký sinh của chế phẩm cũng sẽ thay đổi tùy theo các điều kiện thông dụng như tác dụng và khoảng thời gian diệt vật ký sinh mong muốn, loài cụ thể đã nêu, phương thức sử dụng, và các điều kiện tương tự.

Thông thường, tốt hơn là áp dụng hợp chất theo sáng chế với tổng lượng nằm trong khoảng từ 0,5 mg/kg đến 100 mg/kg mỗi ngày, tốt hơn từ 1 mg/kg đến 50 mg/kg mỗi ngày.

Để sử dụng theo đường miệng cho động vật máu nóng, hợp chất có công thức I có thể được phối chế ở dạng thức ăn cho động vật, thức ăn trộn sẵn cho động vật, thức ăn cô đặc cho động vật, viên tròn, dung dịch, hỗn hợp đặc, huyền phù, tẩm ướt, dạng gel, viên nén, tiêm nhanh và viên nang. Ngoài ra, hợp chất có công thức I có thể được dùng cho động vật trong nước uống của chúng. Để dùng theo đường uống, dạng liều bào chế lựa chọn cần phải cung cấp cho động vật từ 0,01 mg/kg đến 100 mg/kg khối lượng cơ thể động vật mỗi ngày đối với hợp chất có công thức I, tốt hơn từ 0,5 mg/kg đến 100 mg/kg khối lượng cơ thể động vật mỗi ngày.

Theo cách khác, hợp chất có công thức I có thể được dùng cho động vật theo đường ngoài tiêu hóa, ví dụ, theo đường trong dạ cỏ, trong cơ, tĩnh mạch hoặc tiêm dưới da. Hợp chất có công thức I có thể được phân tán hoặc hòa tan trong chất mang có thể chấp nhận được về mặt sinh lý để tiêm dưới da. Theo cách khác, hợp chất có công thức I có thể được phối chế thành dạng implant để sử dụng cấy dưới da. Ngoài ra, hợp chất có công thức I có thể được dùng theo đường qua da cho động vật. Để dùng theo đường ngoài tiêu hóa, dạng liều bào chế lựa chọn cần phải cung cấp cho động vật từ 0,01 mg/kg đến 100 mg/kg khối lượng cơ thể động vật mỗi ngày đối với hợp chất có công thức I.

Hợp chất có công thức I cũng có thể được áp dụng tại chỗ cho động vật ở dạng nhúng, bụi, bột, vòng đeo cổ, vật đeo, dạng phun, nước gội, chế phẩm để chấm lên da và rót ra dùng và ở dạng mỡ bôi hoặc nhũ tương dầu trong nước hoặc nước trong dầu. Để dùng tại chỗ, dạng nhúng và phun thông thường chứa 0,5 ppm đến 5000 ppm và tốt hơn từ 1 ppm đến 3000 ppm của hợp chất có công thức I. Ngoài ra, hợp chất có công thức I có thể được phối chế ở dạng thẻ đeo tai cho động vật, nhất là động vật bốn chân như gia súc và cừu.

Các chế phẩm thích hợp là:

- dung dịch như dung dịch uống, dịch cô đặc để dùng theo đường uống sau khi pha loãng, dung dịch để sử dụng trên da hoặc trong các hốc trên cơ thể, chế phẩm để rót ra dùng, gel;

- nhũ tương và huyền phù để dùng theo đường uống hoặc trên da; chế phẩm bán rắn;

- chế phẩm trong đó, hoạt chất được xử lý ở dạng nền bôi hoặc ở dạng nền nhũ tương dầu trong nước hoặc nước trong dầu;

- chế phẩm rắn như bột, hỗn hợp trộn sẵn hoặc chế phẩm cô, hạt, viên, viên nén, tiêm nhanh, nang; sol khí và dạng xông, và các vật phẩm tạo hình chứa hoạt chất.

Các chế phẩm thích hợp để tiêm được bào chế bằng cách hòa tan thành phần hoạt tính trong dung môi thích hợp và tùy ý bổ sung thêm các chất hỗ trợ như axit, bazơ, muối đệm, chất bảo quản và chất hòa tan. Các chất hỗ trợ thích hợp cho dung dịch tiêm là đã biết trong lĩnh vực. Dung dịch được lọc và đóng lọ vô trùng.

Dung dịch uống được dùng trực tiếp. Dịch cô đặc được dùng theo đường uống sau khi pha loãng trước tới nồng độ sử dụng. Dung dịch uống và dịch cô đặc được điều chế theo phương pháp đã biết và như được mô tả ở trên đối với dung dịch tiêm, các phương thức vô khuẩn không cần thiết.

Dung dịch để dùng trên da được nhỏ giọt lên da, bôi rộng, chà sát, rắc lên da hoặc phun lên da. Dung dịch để dùng trên da được bào chế theo phương pháp đã biết và như được mô tả ở trên đối với dung dịch tiêm, các quy trình tiệt trùng là không cần thiết.

Gel được áp dụng lên hoặc bôi rộng lên da hoặc đưa vào các hốc trên cơ thể. Gel được bào chế bằng cách xử lý dung dịch mà nó đã được bào chế như đã mô tả trong trường hợp dung dịch tiêm cùng với lượng đủ chất làm đặc để tạo ra vật liệu trong có độ sệt như thuốc mỡ. Chất làm đặc thích hợp là đã biết trong lĩnh vực.

Chế phẩm rót ra dùng được rót hoặc phun lên các vùng giới hạn của da, hoạt chất thấm qua da và tác động toàn thân. Chế phẩm rót ra dùng được điều chế bằng cách hòa tan, tạo huyền phù hoặc nhũ tương hóa hoạt chất trong dung môi tương thích với da thích hợp hoặc hỗn hợp các dung môi. Nếu thích hợp, các chất hỗ trợ khác như chất tạo màu, chất

tăng cường hấp thu sinh học, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng, chất kết dính được bổ sung. Các chất bổ trợ thích hợp là đã biết trong lĩnh vực.

Nhũ tương có thể được dùng theo đường uống, qua da hoặc ở dạng tiêm. Nhũ tương thuộc loại nước trong dầu hoặc dầu trong nước. Nhũ tương được điều chế bằng cách hòa tan hoạt chất ở pha kị nước hoặc ở pha ưa nước và đồng nhất hóa hỗn hợp bằng dung môi ở pha khác với sự hỗ trợ của chất nhũ hóa thích hợp và nếu phù hợp, các chất bổ trợ khác như chất tạo màu, chất tăng cường hấp thu, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng, chất tăng cường độ nhớt. Các pha kị nước thích hợp (dầu), các pha ưa nước thích hợp, chất nhũ hóa thích hợp và các chất bổ trợ thích hợp khác dùng cho nhũ tương là đã biết trong lĩnh vực.

Huyền phù có thể được dùng theo đường uống hoặc tại chỗ/quá da. Huyền phù được điều chế bằng cách tạo huyền phù hoạt chất trong chất tạo huyền phù, nếu thích hợp với việc bổ sung các chất bổ trợ khác như chất tạo ẩm, chất tạo màu, chất tăng cường hấp thu sinh học, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất ổn định ánh sáng. Chất tạo huyền phù thích hợp và các chất bổ trợ thích hợp khác dùng cho huyền phù bao gồm cả chất tạo ẩm là đã biết trong lĩnh vực.

Chế phẩm bán rắn có thể được dùng qua đường miệng hoặc tại chỗ/quá da. Chúng khác so với huyền phù và nhũ tương mô tả ở trên chỉ duy nhất bởi độ nhớt cao hơn của nó.

Chế phẩm bán rắn khác với huyền phù và nhũ tương mô tả ở trên chỉ duy nhất bởi độ nhớt cao hơn của nó. Các chất bổ trợ thích hợp cho mục đích này là đã biết trong lĩnh vực.

Chế phẩm mà có thể được sử dụng theo sáng chế thông thường có thể chứa từ 0,001 đến 95% hợp chất theo sáng chế.

Chế phẩm sẵn sàng để dùng chứa các hợp chất hoạt động chống lại vật ký sinh, tốt hơn là vật ngoại ký sinh, với nồng độ nằm trong khoảng từ 10 ppm đến 80% khối lượng, tốt hơn từ 0,1 đến 65% khối lượng, tốt hơn nữa từ 1 đến 50% khối lượng, tốt nhất từ 5 đến 40% khối lượng.

Chế phẩm mà được pha loãng trước khi dùng chứa các hợp chất hoạt động chống lại vật ngoại ký sinh với nồng độ nằm trong khoảng từ 0,5 đến 90% khối lượng, tốt hơn từ 1 đến 50% khối lượng.

Ngoài ra, chế phẩm chứa hợp chất có công thức I chống lại vật nội ký sinh với nồng độ nằm trong khoảng từ 10 ppm đến 2% khối lượng, tốt hơn từ 0,05 đến 0,9% khối lượng, tốt nhất từ 0,005 đến 0,25% khối lượng.

Ngoài ra, chế phẩm chứa hợp chất có công thức I chống lại vật nội ký sinh với nồng độ nằm trong khoảng từ 10 ppm đến 2% khối lượng, tốt hơn từ 0,05 đến 0,9% khối lượng, tốt nhất từ 0,005 đến 0,25% khối lượng.

Thông thường tốt hơn nên dùng chế phẩm rắn mà nó giải phóng ra hợp chất theo sáng chế với tổng lượng nằm trong khoảng từ 10 mg/kg đến 300 mg/kg, tốt hơn từ 20 mg/kg đến 200 mg/kg, tốt nhất từ 25 mg/kg đến 160 mg/kg khối lượng cơ thể của động vật được điều trị trong thời gian ba tuần.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế được minh họa cụ thể hơn bởi các ví dụ sau đây, không nhằm giới hạn phạm vi của sáng chế theo cách bất kỳ.

Bằng cách thay đổi thích hợp các nguyên liệu ban đầu, các quy trình như được mô tả trong các ví dụ dưới đây được sử dụng để thu được các hợp chất có công thức chất I khác. Các hợp chất thu được theo cách này cùng với các số liệu vật lý, được liệt kê trong các bảng dưới đây.

Phương pháp LC/MS:

Máy: Shimadzu Nexera UHPLC + Shimadzu LCMS 20-20, ESI

Cột: Phenomenex Kinetex 1,7 μ m XB-C18 100A, 50 x 2,1mm"

Phương pháp:

Pha động: A: nước + 0,1% TFA; B:CAN; Nhiệt độ: 60°C; Gradien: 5% B đến 100% B trong 1,50 phút; 100% B 0,25 phút; Lưu lượng: 0,8ml/phút đến 1,0ml/phút trong 1,51 phút

Phương pháp MS: ESI dương tính, khoảng khối lượng (m/z): 100-700

Ví dụ 1: Tổng hợp 2-[3-ethylsulfonyl-6-[3-(triflometyl)-1,2,4-triazol-1-yl]-2-pyridyl]-6-methyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (I-1-1):

a) 2-bromo-1-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon được tổng hợp theo các quy trình được công bố: WO2016/71214.

b) 1-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon:

Bước 1: Dung dịch gồm axit 3,6-diclopicolinic (120 g, 0,628 mol) trong toluen (2L), ở nhiệt độ trong phòng, được bổ sung thionyl clorua (68,38 mL, 0,942 mol) và DMF (9,0 mL). Sau đó, phản ứng được làm ấm tới 110°C và được khuấy trong 2 h. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được cô trong chân không, để thu được phần cặn. Phần cặn được hòa tan trong toluen (2L) và sau đó là etan thiol (40,8g, 0,659 mol) được bổ sung nhỏ giọt trong 15 phút, sau đó phản ứng được khuấy trong 1h ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng sau đó được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 10% EtOAc-Petete để thu được S-ethyl 3,6-diclopyridin-2-carbothioat là chất rắn màu vàng (120g, hiệu suất 81%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 7,77 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 7,44 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 3,03 (q, 2H, $J = 7,2$ Hz), 1,36 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz).

Bước 2: Dung dịch gồm natri hydroxit (37,45 g, 0,936 mol) trong nước (200 mL) được bổ sung etanethiol (67,64 mL, 0,936 mol) nhỏ giọt trong 15 phút, sau đó phản ứng được khuấy ở cùng một nhiệt độ trong 30 phút. Sau đó, tetrabutylammoni bromua (45,27 g, 0,14 mol) được bổ sung và phản ứng được khuấy trong 30 phút. Dung dịch gồm S-ethyl 3,6-diclopyridin-2-carbothioat (110 g, 0,468 mol) trong toluen (300 mL) sau đó được bổ sung nhỏ giọt vào hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ trong phòng và phản ứng được khuấy trong 5 h nữa ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được đổ vào nước (500 mL) và được chiết bằng etylaxetat (3x600 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại được làm khô trên Na_2SO_4 khan và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn thô được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 15% EtOAc-Petete để thu được S-ethyl 6-clo-3-ethylsulfonyl-pyridin-2-carbothioat ở dạng chất rắn màu trắng nhò (98g, hiệu suất 80%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 7,63 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 7,40 (d, 1H, $J = 8,8$ Hz), 3,02 (q, 2H, $J = 7,2$ Hz), 2,96 (q, 2H, $J = 7,6$ Hz), 1,40 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz), 1,36 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz).

Bước 3: Dung dịch gồm S-etyl 6-clo-3-etylsulfanyl-pyridin-2-carbothioat (70 g, 0,268 mol) trong etanol (300 mL) được bổ sung dung dịch lithi hydroxit (17,28 g, 0,402 mol) sau đó hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 5 h. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn được hòa tan trong nước lạnh, được axit hóa bằng 2N HCl trong khi đó axit 6-clo-3-etylsulfanyl-pyridin-2-carboxylic được kết tủa ở dạng chất rắn màu trắng nhò. Axit 6-clo-3-etylsulfanyl-pyridin-2-carboxylic được gom lại, làm khô và được sử dụng mà không cần tinh chế thêm (55g, hiệu suất 94%). ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6): δ 13,63 (s, 1H), 7,94 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 7,63 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 2,99 (q, 2H, $J = 7,2$ Hz), 1,24 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz).

Bước 4: Dung dịch gồm axit 6-clo-3-etylsulfanyl-pyridin-2-carboxylic (55 g, 0,253 mol) trong toluen (600 mL) ở nhiệt độ trong phòng, được bổ sung thionyl clorua (27 mL, 0,380 mol) và DMF (1,5 mL) và sau đó hỗn hợp phản ứng được làm ấm tới 110°C và được khuấy trong 2 h. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh tới nhiệt độ phòng và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn được đưa vào trong DCM (1L) và được bổ sung vào dung dịch gồm N,O-dimethylhydroxylamin hydroclorua (47,32 g, 0,484 mol) & DIPEA (127,11 mL, 0,727 mol) trong DCM (1L) nhỏ giọt ở 0°C trong 2 h. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm ấm tới nhiệt độ phòng và khuấy trong 4 h. Hỗn hợp phản ứng sau đó được đổ vào nước (600 mL) và được chiết bằng DCM (2x600 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại được làm khô trên Na_2SO_4 khan và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn thô được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 20% EtOAc-Petete để thu được 6-clo-3-etylsulfanyl-N-metoxi-N-metyl-pyridin-2-carboxamit ở dạng gom màu nâu (54g, hiệu suất 85%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 7,71 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 7,31 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 3,60 (s, 3H), 3,37 (s, 3H), 2,92 (t, 2H, $J = 7,2$ Hz), 1,26 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz).

Bước 5: Dung dịch gồm 6-clo-3-etylsulfanyl-N-metoxi-N-metyl-pyridin-2-carboxamit (54 g, 0,207 mol) trong THF khô (500 mL) ở 0°C được bổ sung CH_3MgBr (207,69 mL, 0,623 mol, 3M trong dietyl ete) nhỏ giọt, sau đó hỗn hợp phản ứng được để ấm tới nhiệt độ phòng và khuấy trong 4 h. Sau đó, phản ứng được dừng lại bằng cách bổ

sung dung dịch nước bão hòa NH_4Cl (500 mL) và được chiết bằng EtOAc (2x700 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại được làm khô trên Na_2SO_4 khan và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn thô được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 15% EtOAc-Petete để thu được 1-(6-clo-3-etylsulfanyl-2-pyridyl)etenon ở dạng chất rắn màu trắng nhờ (38g, hiệu suất 85%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 7,64 (d, 1H, $J = 8,8$ Hz), 7,39 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 2,91 (q, 2H, $J = 7,6$ Hz), 2,69 (s, 3H), 1,39 (t, 3H, $J = 7,6$ Hz).

Bước 6: Dung dịch gồm 1-(6-clo-3-etylsulfanyl-2-pyridyl)etanon (38 g, 0,176 mol) trong CH_2Cl_2 (500 mL) ở 0°C được bổ sung *m*-CPBA (76,25 g, 0,441 mol) một phần, sau đó hỗn hợp phản ứng được để ấm tới nhiệt độ phòng và khuấy trong 16 h. Hỗn hợp phản ứng sau đó được đổ vào nước (1,0 L) và được chiết bằng CH_2Cl_2 (2x1 L). Các lớp hữu cơ được gom lại được rửa bằng dung dịch 1M NaOH (2x500 mL) và nước (2x500 mL), được làm khô trên Na_2SO_4 khan và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn thô được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 20% EtOAc-Petete để thu được 1-(6-clo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)etenon ở dạng chất rắn (33g, hiệu suất 75%). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 8,29 (d, 1H, $J = 8,4$ Hz), 7,60 (d, 1H, $J = 8,0$ Hz), 3,54 (q, 2H, $J = 7,6$ Hz), 2,70 (s, 3H), 1,35 (t, 3H, $J = 7,2$ Hz).

c) 2-bromo-1-(5-bromo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)etanon

Dung dịch gồm 1-(6-clo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)etenon (10,00g, 40,4 mmol) trong axit axetic (140 mL) ở nhiệt độ trong phòng, được bổ sung lần lượt HBr (33% trong axit axetic) (8,60g, 49,1 mmol), và brophút (6,55g, 50,0 mmol). Sau đó, phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm, và sau đó được đổ vào 500 mL nước đá khuấy, trong khi đó chất rắn màu trắng được kết tủa. Chất rắn được gom lại được làm khô trong lò chân không ở 50°C trong 18 h để thu được sản phẩm mong muốn (2-bromo-1-(5-bromo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)etenon) pha lẫn 30% sản phẩm chứa clorua (2-bromo-1-(6-clo-3-etylsulfonyl-2-pyridyl)etanon). Hỗn hợp này được sử dụng ở bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

LC-MS 2-bromo-1-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon: khối lượng được tính đối với $C_9H_{10}NO_3SBr_2$ $[M+H]^+$ 372,0, tìm thấy 371,7; $t_R = 1,027$ phút (t_R : thời gian lưu).

LC-MS 2-bromo-1-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon: khối lượng được tính đối với $C_9H_{10}NO_3SBrCl$ $[M+H]^+$ 325,9, tìm thấy 325,8; $t_R = 1,007$ phút (t_R : thời gian lưu).

d) 2-(6-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on:

Dung dịch gồm 3,0g gồm hỗn hợp với tỷ lệ 7:3 của 2-bromo-1-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon và 2-bromo-1-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon được tạo ra trên đây và 4-amino-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2-on (1,55, 8,02 mmol) được hòa tan trong 70 ml 1,4-Dioxan và được gia nhiệt tới $110^\circ C$ trong 72 h. Sau đó phản ứng được làm lạnh tới nhiệt độ phòng và được cô trong chân không để thu được phần cặn. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký silicagel (25% n-heptan/ CH_2Cl_2) để thu được 1,55g hỗn hợp với tỷ lệ 7:3 gồm 2-(6-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on và 2-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on ở dạng chất rắn màu trắng nhờ.

LC-MS 2-(6-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on: khối lượng được tính đối với $C_{15}H_{13}N_4O_3F_3SBr$ $[M+H]^+$ 466,2, tìm thấy 466,9; $t_R = 1,109$ phút (t_R : thời gian lưu).

LC-MS 2-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on: khối lượng được tính đối với $C_{15}H_{13}N_4O_3F_3SCl$ $[M+H]^+$ 421,0, tìm thấy 420,9; $t_R = 1,089$ phút (t_R : thời gian lưu).

e) 2-[3-ethylsulfonyl-6-[3-(triflometyl)-1,2,4-triazol-1-yl]-2-pyridyl]-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (I-1-1):

Dung dịch gồm 3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol (0,162g, 1,18 mmol) trong NMP (3 mL) ở nhiệt độ trong phòng, được bổ sung NaH (0,072g, 1,18 mmol, 60% huyền phù trong dầu khoáng được sử dụng) một phần. Phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 30 phút và sau đó hỗn hợp với tỷ lệ 7:3 gồm 2-(6-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on và 2-(6-clo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-

metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (0,220g, 0,473 mmol) được tạo ra trên đây, được bổ sung một phần. Sau đó phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Sau đó phản ứng được đổ vào nước (50 mL) và được chiết vào EtOAc (3x50 mL), các lớp hữu cơ được gom lại được làm khô trên Na₂SO₄ khan và được cô trong điều kiện áp suất giảm để thu được phần cặn. Phần cặn thô được tinh chế bằng sắc ký cột rửa giải bằng 0→50% EtOAc-xyclohexan để thu được 2-[3-etylsulfonyl-6-[3-(triflometyl)-1,2,4-triazol-1-yl]-2-pyridyl]-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on ở dạng chất rắn màu nâu (0,140g, hiệu suất 54%).

LC-MS: khối lượng được tính đối với C₁₈H₁₄N₇O₃F₆S [M+H]⁺ 522,4, tìm thấy 522,0; t_R= 1,270 phút (t_R: thời gian lưu).

Ví dụ 2: 2-[3-etylsulfonyl-5-(2-oxopyrrolidin-1-yl)-2-pyridyl]-6-metyl-7-(triflometyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (I-1-3):

a) 4-amino-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2-on

Bước 1: Bổ sung dung dịch p-metoxibenzylamin (13,7 g) trong CH₂Cl₂ (200 mL), sau đó bổ sung từng giọt Et₃N (30 mL) trong CH₂Cl₂ (100 mL) vào dung dịch triphosgen (29,6 g) trong CH₂Cl₂ (200 mL). Khuấy hỗn hợp thu được ở 25°C trong 14 giờ. Bổ sung nước (500 mL) vào và chiết hỗn hợp phản ứng bằng CH₂Cl₂ (3 × 200 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại, rửa bằng dung dịch NH₄Cl bão hòa (600 mL), nước muối (600 mL), làm khô bằng Na₂SO₄, lọc, và cô để thu được 1-(isoxyanatometyl)-4-metoxi-benzen (17 g, chất thô) dưới dạng dầu màu vàng. ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz) δ 7,26 (d, J=8,8 Hz, 2H), 6,95 (d, J=8,4 Hz, 2H), 4,45 (s, 2H), 3,85 (s, 3H).

Bước 2: Bổ sung NaH (6 g) thành từng phần ở 0°C vào dung dịch etyl (Z)-3-amino-4,4,4-triflo-but-2-enoat (19 g) trong DMF (500 mL). Sau đó hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 0°C trong 1 giờ. Sau đó bổ sung hỗn hợp này vào 1-(isoxyanatometyl)-4-metoxi-benzen (17 g) ở 0°C. Khuấy hỗn hợp thu được ở nhiệt độ 0°C đến 25°C trong 14 giờ. Loại bỏ dung môi trong điều kiện áp suất giảm và bổ sung nước (1 L) vào đó, và lớp hữu cơ được tách ra. Lớp nước được chiết bằng EtOAc (3 × 500 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại, rửa bằng nước muối (500 mL), làm khô bằng Na₂SO₄, lọc, và cô để thu được 3-[(4-

metoxyphenyl)methyl]-6-(triflometyl)-1H-pyrimidin-2,4-dion thô (15 g) dưới dạng dầu màu vàng. ^1H NMR (MeOD, 400 MHz) δ 7,27 (d, $J=8,8$ Hz, 2H), 6,77 (d, $J=8,4$ Hz, 2H), 5,80 (s, 1H), 5,02 (s, 2H) 3,70 (s, 3H).

Bước 3: Bổ sung MeI (16,5 g, 7,24 mL, 116,2 mmol) ở 25°C vào dung dịch chứa 3-[(4-metoxypheyl)metyl]-6-(triflometyl)-1H-pyrimidin-2,4-dion (35 g) và K_2CO_3 (16 g) trong DMF (300 mL). Sau đó hỗn hợp thu được được khuấy ở 25°C trong 12 giờ. Dung môi được loại bỏ trong điều kiện áp suất giảm. Bổ sung nước (300 mL) vào đó và tách lớp hữu cơ. Lớp nước được chiết bằng EtOAc (3×300 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại, rửa bằng nước muối (500 mL), làm khô bằng Na_2SO_4 , lọc, và cô để thu được 3-[(4-metoxypheyl)metyl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4-dion thô (30 g) dưới dạng chất rắn màu vàng. ^1H NMR (MeOD, 400 MHz) δ 7,35 (d, $J=8,8$ Hz, 2H), 6,83 (d, $J=8,8$ Hz, 2H), 6,28 (s, 1H), 5,02 (s, 2H), 3,75 (s, 3H), 3,46 (s, 3H).

Bước 4: Bổ sung xeric amoni nitrat (78,5 g) ở 25°C vào dung dịch 3-[(4-metoxypheyl)metyl]-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4-dion (30 g) trong CH_3CN (200 mL) và nước (50 mL). Sau đó khuấy hỗn hợp phản ứng ở 25°C trong 14 giờ, sau đó bổ sung thêm một phần (50 g) xeric amoni nitrat. Khuấy hỗn hợp thu được ở 25°C trong 14 giờ. Bổ sung nước (200 mL) vào và tách lớp hữu cơ. Chiết lớp nước bằng EtOAc (3×100 mL). Các lớp hữu cơ được gom lại, rửa bằng dung dịch nước NaHCO_3 (500 mL), làm khô bằng Na_2SO_4 , lọc, và cô. Cặn được tinh chế bằng sắc ký silicagel (PE:EtOAc = gradient từ 10:1 đến 1:1) để thu được 1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4-dion (8 g) dưới dạng chất rắn màu vàng. ^1H NMR (MeOD, 400 MHz) δ 6,20 (s, 1H), 3,44 (s, 3H).

Bước 5: Bổ sung từng giọt Tf_2O (36,7 g) ở 0°C vào dung dịch 1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2,4-dion (8 g) trong DCM (150 mL) và pyridin (30 mL). Sau đó hỗn hợp được khuấy ở 0°C đến 25°C trong 3 giờ. Amoniac dạng khí được cho qua MeOH (50 mL) ở -70°C trong 20 phút và dung dịch metanol amoniac thu được được rót vào hỗn hợp phản ứng. Hỗn hợp thu được được khuấy ở 25°C trong 12 giờ. Dung môi được loại bỏ trong điều kiện áp suất giảm. Cặn được tinh chế bằng HPLC điều chế để thu được 4-amino-1-metyl-6-(triflometyl)pyrimidin-2-on (3,4 g) dưới dạng chất rắn màu vàng. ^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz) δ 7,62 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 6,24 (s, 1 H), 3,30 (s, 3H).

b) 2-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-methyl-7-(triflormethyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on:

Dung dịch gồm 4-amino-1-methyl-6-(triflormethyl)pyrimidin-2-on (0,900g, 4,72 mmol), và 2-bromo-1-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)etenon (1,60 g, 2,30 mmol) trong 1,4-dioxan (40 mL) được khuấy ở 140°C trong lò vi sóng trong 2,5 h. sau đó phản ứng được làm lạnh tới nhiệt độ phòng, được pha loãng bằng EtOAc (200 mL), và được rửa bằng dung dịch nước bão hòa NaHCO₃ (100 mL), được làm khô trên Na₂SO₄, được lọc, và được cô trong chân không để thu được phần cặn. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột qua silicagel (10→80% EtOAc/xyclohexan) để thu được 2-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-methyl-7-(triflormethyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on ở dạng chất rắn (0,700 g, hiệu suất 35%).

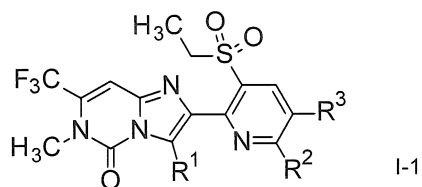
LC-MS: khối lượng được tính đối với C₁₅H₁₂N₄O₃F₃SBr [M+H]⁺ 364,9, tìm thấy 364,9; t_R = 1,128 phút (t_R: thời gian lưu).

c) 2-[3-ethylsulfonyl-5-(2-oxopyrrolidin-1-yl)-2-pyridyl]-6-methyl-7-(triflormethyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (I-1-3):

Dung dịch gồm hợp chất 2-(5-bromo-3-ethylsulfonyl-2-pyridyl)-6-methyl-7-(triflormethyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on (0,150g, 0,322 mmol), trong DMA (1 mL) được bổ sung lần lượt pyrrolidin-2-on (0,082g, 0,967 mmol), tris(dibenzyliden axeton)dipaladium(0) (Pd₂ dba₃) (0,026g, 0,032 mmol), xantphos (0,056g, 0,097 mmol), và Cs₂CO₃ (0,210g, 0,645 mmol). Sau đó, dung dịch được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 10 phút, và được phản ứng tiếp ở 150 °C trong 15 phút trong lò phản ứng vi sóng (bức xạ 50 W). Hỗn hợp phản ứng được làm lạnh tới nhiệt độ phòng, được lọc qua đệm xelit và được cô trong chân không để thu được phần cặn. Phần cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (1→20% MeOH/CH₂Cl₂) để thu được 2-[3-ethylsulfonyl-5-(2-oxopyrrolidin-1-yl)-2-pyridyl]-6-methyl-7-(triflormethyl)imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-on ở dạng chất rắn màu vàng nhạt (0,070g, hiệu suất 46%).

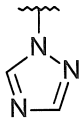
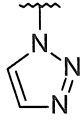
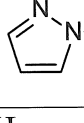
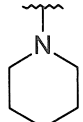
LC-MS: khối lượng được tính đối với C₁₉H₁₈N₅O₄F₃S [M+H]⁺ 470,1, tìm thấy 470,0; t_R = 0,986 phút (t_R: thời gian lưu).

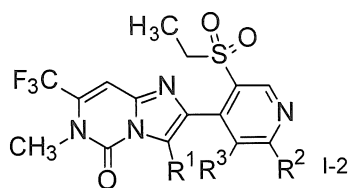
Theo quy trình tương tự như quy trình được mô tả nêu trên, các ví dụ dưới đây có công thức I-1 và I-2 được điều chế.



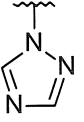
Bảng I-1:

Số	R ¹	R ²	R ³	RT (phút)	m/z (M+H)
I-1-1	H		H	1,27	522,0
I-1-2	H		H	1,038	455,1
I-1-3	H	H		0,986	470,0
I-1-4	H	H		1,125	482,0
I-1-5	H		H	1,033	453,9
I-1-6	H		H	1,048	454,0
I-1-7	H	H		1,198	468,9

Số	R ¹	R ²	R ³	RT (phút)	m/z (M+H)
I-1-8	CH ₃		H	1,068	467,9
I-1-9	CH ₃		H	1,085	468,0
I-1-10	H		H	1,14	453,0
I-1-11	H	H		1,16	470,1



Bảng I-2:

Số	R ¹	R ²	R ³	RT (phút)	m/z (M+H)
I-2-1	H		H	1,032	453,9

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

Nếu không có quy định khác, hầu hết các dung dịch thử nghiệm được điều chế như sau:

Hòa tan hoạt chất ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp gồm nước cất:axeton với tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích). Dung dịch thử nghiệm được điều chế vào ngày sử dụng.

Mọt ăn bông vải (*Anthonomus grandis*)

Để đánh giá việc phòng trừ mọt ăn bông vải (*Anthonomus grandis*), thiết bị thử nghiệm gồm đĩa vi chuẩn độ 96 lỗ chứa thức ăn cho côn trùng và 5-10 trứng *A. grandis*.

Hợp chất được phối chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% thể tích/thể tích nước và 25% thể tích/thể tích DMSO. Hợp chất đã được điều chế với các nồng độ khác nhau được phun vào thức ăn cho côn trùng ở mức 5 μ l, bằng cách sử dụng thiết bị phun vi lượng được sản xuất theo đơn đặt hàng, thực hiện hai bản sao.

Sau khi phun, các đĩa vi chuẩn độ được ủ ở nhiệt độ khoảng $25 \pm 1^\circ\text{C}$ và độ ẩm tương đối khoảng $75 \pm 5\%$ trong 5 ngày. Tiếp theo, tỷ lệ tiêu diệt trứng và ấu trùng được đánh giá bằng mắt thường.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9, và I-1-10 ở 2500 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Sâu bướm thuốc lá (*Heliothis virescens*)

Để đánh giá việc phòng trừ sâu bướm thuốc lá (*Heliothis virescens*), thiết bị thử nghiệm gồm đĩa vi chuẩn độ 96 lỗ chứa thức ăn cho côn trùng và 15-25 trứng *H. virescens*.

Hợp chất được phối chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% thể tích/thể tích nước và 25% thể tích/thể tích DMSO. Hợp chất đã được điều chế với các nồng độ khác nhau được phun vào thức ăn cho côn trùng ở mức 10 μ l, bằng cách sử dụng thiết bị phun vi lượng được sản xuất theo đơn đặt hàng, thực hiện hai bản sao.

Sau khi phun, các đĩa vi chuẩn độ được ủ ở nhiệt độ khoảng $28 \pm 1^\circ\text{C}$ và độ ẩm tương đối khoảng $80 \pm 5\%$ trong 5 ngày. Tiếp theo, tỷ lệ tiêu diệt trứng và ấu trùng được đánh giá bằng mắt thường.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9, và I-1-10 ở 2500 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Rệp đậu tằm (*Megoura viciae*)

Để đánh giá việc phòng trừ rệp đậu tằm (*Megoura viciae*) nhờ phương pháp tiếp xúc hoặc phương pháp toàn thân, thiết bị thử nghiệm gồm đĩa vi chuẩn độ 24 lỗ chứa các đĩa lá đậu rộng.

Hợp chất được phối chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% thể tích/thể tích nước và 25% thể tích/thể tích DMSO. Hợp chất đã được điều chế với các nồng độ khác nhau được phun vào đĩa lá ở 2,5 µl, bằng cách sử dụng thiết bị phun vi lượng được sản xuất theo đơn đặt hàng, thực hiện hai bản thử nghiệm.

Sau khi dùng hợp chất, đĩa lá được làm khô bằng không khí và 5 – 8 rệp cây trưởng thành được đặt lên đĩa lá bên trong các lỗ của đĩa vi chuẩn độ. Sau đó, rệp cây được để hút trên các đĩa lá đã được xử lý và được ủ ở khoảng $23 \pm 1^\circ\text{C}$ và khoảng $50 \pm 5\%$ độ ẩm tương đối trong 5 ngày. Sau đó, tỷ lệ tiêu diệt và khả năng sinh sản của rệp được đánh giá bằng mắt thường.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-6, I-1-9, và I-1-10 ở 2500 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Rệp hại đậu đũa (*Aphis craccivora*)

Hòa tan hoạt chất ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp gồm nước cất:axeton theo tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích). Bổ sung chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) với tỷ lệ 0,01% (thể tích/thể tích). Dung dịch thử nghiệm được điều chế vào ngày sử dụng.

Cây đậu đũa trồng trong chậu được cho định cư khoảng 30 - 50 con rệp ở các giai đoạn khác nhau bằng cách chuyển bằng tay một miếng mô lá cắt từ cây đã bị nhiễm 24 giờ trước khi áp dụng. Các cây được phun các dung dịch thử nghiệm bằng cách sử dụng máy phun cầm tay DeVilbiss® ở áp suất 20-30 psi ($\approx 1,38$ đến $2,07$ bar) sau khi quần thể sinh

vật gây hại đã được kiểm tra. Các cây đã xử lý được giữ trên xe kéo ở nhiệt độ 25- 26°C. Tỷ lệ chết theo phần trăm được đánh giá sau 72 giờ.

Trong thử nghiệm này, hợp chất I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-6, I-1-7, I-1-8, và I-1-9 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Bọ nhảy màu xanh hại lúa (*Nephotettix virescens*)

Các cây lúa từ bốn đến năm tuần tuổi đã được cắt phần lá phía trên được làm sạch và rửa 24 giờ trước khi phun. Hoạt chất được phối chế trong hỗn hợp axeton:nước ở tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích), và 0,01% thể tích/thể tích chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) được bổ sung vào đó. Mạ lúa đã mọc trong chậu được phun 5-6 ml dung dịch thử nghiệm, được làm khô bằng không khí, được đưa vào nhà lưới Mylar và ủ với 10 bọ nhảy trưởng thành. Cây lúa đã xử lý được giữ ở khoảng 28-29°C và độ ẩm tương đối khoảng 50-60%. Tỷ lệ tiêu diệt theo phần trăm được ghi lại sau 72 giờ.

Trong thử nghiệm này, hợp chất I-1-3, và I-1-8 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Rầy nâu hại lúa (*Nilaparvata lugens*)

Các cây lúa từ bốn đến năm tuần tuổi được làm sạch và rửa 24 giờ trước khi phun. Hoạt chất được bào chế trong hỗn hợp axeton:nước ở tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích), và 0,01% thể tích/thể tích chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) được bổ sung. Mạ lúa đã mọc trong chậu được phun 5-6 ml dung dịch thử nghiệm, được làm khô bằng không khí, được đưa vào nhà lưới Mylar và ủ với 10 con rầy nâu trưởng thành. Cây lúa đã xử lý được giữ ở khoảng 28-29°C và độ ẩm tương đối khoảng 50-60%. Tỷ lệ tiêu diệt theo phần trăm được ghi lại sau 72 giờ.

Trong thử nghiệm này, hợp chất I-1-3 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Sâu tơ (*Plutella xylostella*)

Hòa tan hoạt chất ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp gồm nước cất:axeton theo tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích). Bổ sung chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) ở tỷ lệ 0,01% (thể tích/thể tích). Điều chế dung dịch thử nghiệm vào ngày sử dụng.

Lá cải bắp được nhúng trong dung dịch thử nghiệm và được làm khô bằng không khí. Đặt lá đã xử lý vào đĩa petri được lót với giấy lọc đã được làm ẩm và ủ với mười ấu trùng tuổi thứ 3. Tỷ lệ tiêu diệt được ghi lại 72 giờ sau khi xử lý. Tổn hại do ăn lá cũng được ghi lại bằng cách sử dụng thang điểm 0-100%.

Trong thử nghiệm này, hợp chất I-1-1, I-1-4, I-1-5, I-1-6, và I-1-8 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Để đánh giá việc phòng trừ rệp hại đào màu xanh lá cây (*Myzus persicae*) qua phương thức toàn thân, thiết bị thử nghiệm gồm các đĩa vi chuẩn độ 96 lỗ chứa thức ăn nhân tạo ở dạng lỏng dưới màng nhân tạo.

Hợp chất được phối chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 75% thể tích/thể tích nước và 25% thể tích/thể tích DMSO. Hợp chất đã được điều chế với các nồng độ khác nhau được hút bằng pipet vào thức ăn dành cho rệp, bằng cách sử dụng pipet được chế tạo theo đơn đặt hàng riêng, mỗi nồng độ có hai bản sao.

Sau khi áp dụng, 5– 8 con rệp trưởng thành được đặt lên màng nhân tạo bên trong các lỗ của đĩa vi chuẩn độ. Sau đó, rệp cây được để hút trên thức ăn cho rệp đã được xử lý và được ủ ở khoảng $23 \pm 1^{\circ}\text{C}$ và độ ẩm tương đối khoảng $50 \pm 5\%$ trong 3 ngày. Sau đó, tỷ lệ tiêu diệt và khả năng sinh sản của rệp được đánh giá bằng mắt thường.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9, và I-1-10 ở 2500 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Sâu xanh Southern (*Spodoptera eridania*)

Hoạt chất được chế hóa bằng bộ xử lý chất lỏng Tecan trong 100% xyclohexanon dưới dạng dung dịch 10,000 ppm được bổ sung vào các ống. Dung dịch 10,000 ppm được pha loãng theo dãy trong xyclohexanon 100% để tạo dung dịch chuyển tiếp. Các dung dịch

chuyển tiếp này được dùng làm dung dịch gốc để dung dịch pha loãng cuối cùng được tạo ra bằng bộ xử lý Tecan trong 50% axeton : 50% nước (thể tích/thể tích) trong các ống 10 hoặc 20ml. Chất hoạt động bề mặt không ion (Kinetic®) được đưa vào dung dịch ở thể tích 0,01% (thể tích/thể tích). Tiếp theo, các ống được lắp vào thiết bị phun tĩnh điện tự động được lắp vòi phun mù để phun lên thực vật/côn trùng.

Cây đậu Lima (giống Sieva) được trồng 2 cây trong một chậu và được chọn để xử lý ở giai đoạn lá thực thứ nhất. Dung dịch thử nghiệm được phun lên tán lá bằng thiết bị phun tĩnh điện tự động dùng cho thực vật được lắp vòi phun mù. Cây được làm khô trong tủ hút có thiết bị phun và sau đó được lấy ra khỏi thiết bị phun. Mỗi chậu được đặt lên trên túi nhựa được đục lỗ với một khóa kéo niêm phong. Khoảng 10 đến 11 ấu trùng sâu xanh được đặt vào trong túi và túi được kéo khóa lại. Các cây thử nghiệm được giữ trong phòng sinh trưởng ở khoảng 25°C và độ ẩm tương đối khoảng 20-40% trong 4 ngày, tránh tiếp xúc trực tiếp với ánh đèn huỳnh quang (chu kỳ sáng 24 giờ) để ngăn ngừa sự giữ nhiệt bên trong túi. Khả năng chết và lượng thức ăn giảm được xác định 4 ngày sau xử lý, so với các cây đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, hợp chất I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, và I-1-9 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Bọ xít xanh (*Nezara viridula*)

Hòa tan hoạt chất ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp gồm nước cất:axeton với tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích). Bổ sung chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) ở tỷ lệ 0,01% (thể tích/thể tích). Dung dịch thử nghiệm được điều chế vào ngày sử dụng.

Quả đậu tương được đặt trong đĩa petri 90 x 50 mm thủy tinh được lót giấy lọc đã được làm ẩm và ủ với mười ấu trùng *N. viridula* vòng đời thứ 3. Bằng cách sử dụng thiết bị phun cầm tay, khoảng 2 ml dung dịch được phun vào mỗi đĩa Petri. Các cốc đã xử lý được giữ ở khoảng 25-26°C và độ ẩm tương đối khoảng 65-70%. Tỷ lệ tiêu diệt theo phần trăm được ghi lại sau 5 giờ.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-3, và I-1-8 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Bọ phấn (*Bemisia argentifolii*)

Hoạt chất được chế hóa bằng bộ xử lý chất lỏng Tecan trong 100% xyclohexanon dưới dạng dung dịch 10,000 ppm được bổ sung vào các ống. Dung dịch 10,000 ppm được pha loãng theo dãy trong xyclohexanon 100% để tạo dung dịch chuyển tiếp. Các dung dịch chuyển tiếp này được dùng làm dung dịch gốc để dung dịch pha loãng cuối cùng được tạo ra bằng bộ xử lý Tecan trong 50% axeton : 50% nước (thể tích/thể tích) trong các ống 5 hoặc 10ml. Chất hoạt động bề mặt không ion (Kinetic®) được đưa vào dung dịch ở thể tích 0,01% (thể tích/thể tích). Tiếp theo, các ống được lắp vào thiết bị phun tĩnh điện tự động được lắp vòi phun mù để phun lên thực vật/côn trùng.

Các cây bông ở giai đoạn lá mầm (mỗi chậu một cây) được phun bằng thiết bị phun tĩnh điện tự động dùng cho thực vật được lắp vòi phun mù. Cây được làm khô trong tủ hút có thiết bị phun và sau đó được lấy ra khỏi thiết bị phun. Mỗi chậu được đặt vào cốc nhựa và khoảng 10 đến 12 con rầy trưởng thành (khoảng 3-5 ngày tuổi) được đưa vào. Các con rầy được gom bằng cách sử dụng máy hút và ống Tygon® không độc nối với ống hút có chắn. Ống hút này, chứa các con rầy đã gom được, tiếp theo, được nhét nhẹ vào đất chứa cây đã xử lý, để chocasccon rầy trườn ra khỏi ống để đến các lá để ăn. Các cốc được đậy bằng nắp lưới dùng lại được. Thực vật thử nghiệm được giữ trong phòng sinh trưởng ở nhiệt độ khoảng 25°C và độ ẩm tương đối khoảng 20-40% trong 3 ngày, tránh tiếp xúc trực tiếp với ánh đèn huỳnh quang (chu kỳ sáng 24 giờ) để ngăn ngừa sự giữ nhiệt bên trong túi. tỷ lệ tiêu diệt được xác định 3 ngày sau xử lý, được so với thực vật đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-1, và I-1-4 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

Sâu đục thân sọc nâu (*Chilo suppressalis*)

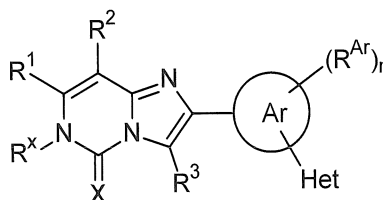
Hòa tan hoạt chất ở nồng độ mong muốn trong hỗn hợp gồm nước cất:axeton theo tỷ lệ 1:1 (thể tích:thể tích). Bổ sung chất hoạt động bề mặt (Kinetic® HV) với tỷ lệ 0,01% (thể tích/thể tích). Dung dịch thử nghiệm được điều chế vào ngày sử dụng.

Mười ấu trùng ở vòng đời đầu tiên được để cho bò trên đĩa petri đã được phun trong 1 phút và sau đó, cung cấp một cọng rom mới cắt vào mỗi đĩa. Sau 10 phút khi toàn bộ ấu trùng đã chui vào bên trong ống đĩa Petri được đậy nắp. Tỷ lệ phần trăm tiêu diệt được ghi nhận sau 72 giờ xử lý.

Trong thử nghiệm này, các hợp chất I-1-4 ở 300 ppm có tỷ lệ tiêu diệt trên 75% so với nhóm đối chứng không được xử lý.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức I:



(I)

trong đó

X là O hoặc S;

R^x được chọn từ nhóm bao gồm C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, $C(O)-OR^a$, NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen- NR^bR^c , $O-C_1$ - C_6 -alkylen- NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen-CN, $NH-C_1$ - C_6 -alkylen- NR^bR^c , $C(O)-NR^bR^c$, $C(O)-R^d$, $SO_2NR^bR^c$, $S(=O)_mR^e$, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

R^1 là H, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy, C_1 - C_6 -alkylsulfenyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, hoặc C_1 - C_6 -alkylsulfonyl mà được thế hoặc không được thế bằng halogen;

R^2 , R^3 độc lập với nhau được chọn từ nhóm bao gồm H, halogen, N_3 , CN, NO_2 , -SCN, -SF₅, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, tri- C_1 - C_6 -alkylsilyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxyx- C_1 - C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, $C(O)-OR^a$, NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen- NR^bR^c , $O-C_1$ - C_6 -alkylen- NR^bR^c , C_1 - C_6 -alkylen-CN, $NH-C_1$ - C_6 -alkylen- NR^bR^c , $C(O)-NR^bR^c$, $C(O)-R^d$, $SO_2NR^bR^c$ và $S(=O)_mR^e$,

một gốc có thể là phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio hoặc benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

Ar là phenyl hoặc heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh,

R^{Ar} độc lập với nhau, được chọn từ nhóm bao gồm halogen, N_3 , OH, CN, NO_2 , -SCN, $-SF_5$, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, tri- C_1 - C_6 -alkylsilyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, $C(O)$ -OR^a, NR^bR^c, C_1 - C_6 -alkylen-NR^bR^c, O- C_1 - C_6 -alkylen-NR^bR^c, C_1 - C_6 -alkylen-CN, NH- C_1 - C_6 -alkylen-NR^bR^c, $C(O)$ -NR^bR^c, $C(O)$ -R^d, SO_2 NR^bR^c và $S(=O)_mR^e$, một gốc cũng có thể là phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio hoặc benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

Het là heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh hoặc heteroxyclyl có 5 hoặc 6 cạnh, mà không được thế hoặc được thế bằng R; với điều kiện R là halogen, oxo (=O), N_3 , OH, CN, NO_2 , SCN, SF_5 , C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy- C_1 - C_4 alkyl, phenyl, heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh, hoặc heteroxyclyl có 5 hoặc 6 cạnh, trong đó các nhóm vòng của R không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f ; với điều kiện rằng R^{Ar} và Het đều không có mặt trên cùng một nguyên tử của Ar;

mỗi R^a được chọn từ H, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, C_1 - C_6 -alkylen-NR^bR^c, C_1 - C_6 -alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

mỗi R^b được chọn từ H, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, -

(C=O)R, -C(=O)OR, và -C(=O)NR, C₁-C₆-alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó phenyl này không được thế hoặc được thế bằng cách gốc R^f;

mỗi R^c được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, các nhóm này không được thế hoặc được thế bằng halogen, C₁-C₆-alkylen-CN, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f;

mỗi gốc NR^bR^c cũng có thể tạo thành dị vòng có 3 đến 8 cạnh bão hòa, liên kết N, dị vòng này, ngoài nguyên tử nitơ, có thể có 1 hoặc 2 nguyên tử khác loại khác hoặc các gốc nguyên tử khác loại khác được chọn từ O, S(=O)_m và N-R', trong đó R' là H hoặc C₁-C₆-alkyl và trong đó dị vòng liên kết N này không được thế hoặc được thế bằng các gốc được chọn từ halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy và C₁-C₄-haloalkoxy;

mỗi R^d được chọn từ H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f;

mỗi R^e được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen, phenyl và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng R^f;

mỗi R^f được chọn từ halogen, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy, C₃-C₆-xycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-xycloalkoxy-C₁-C₄-alkyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1 hoặc 2;

n bằng 0, 1 hoặc 2;

và các N-oxit, chất đồng phân lập thể, chất hồ biến và muối của chúng có thể chấp nhận được trong nông nghiệp hoặc trong thú y.

2. Hợp chất có công thức I theo điểm 1, trong đó X là O.

3. Hợp chất có công thức I theo điểm 1 hoặc 2, trong đó Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, tetrazolyl, và thiadiazolyl;

trong đó Het không được thế hoặc được thế bằng R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

4. Hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó

R^x được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-xycloalkyl, và C₁-C₆-haloalkyl;

R¹ là C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, và C₁-C₆-alkylsulfonyl được chọn từ được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn;

R² được chọn từ H, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₃-C₆-xycloalkyl, và C₃-C₆-xycloalkoxy;

R³ được chọn từ H, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₃-C₆-xycloalkyl, và C₃-C₆-xycloalkoxy;

Ar là phenyl hoặc heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh;

n bằng 1 hoặc 2;

R^{Ar} được chọn từ halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, S(=O)_mR^e, phenyl, phenoxy, phenylcarbonyl, phenylthio và benzyl, trong đó vòng phenyl này không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f;

R^e được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, và C_3 - C_6 -haloxycloalkyl;

R^f được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, và C_2 - C_6 -alkynyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1 hoặc 2.

5. Hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó Ar là heteroaryl có 5 hoặc 6 cạnh chứa một nguyên tử khác loại được chọn từ O, N, và S.

6. Hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, trong đó

R^x là C_1 - C_6 -alkyl;

R^1 được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkylsulfenyl, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, và C_1 - C_6 -alkylsulfonyl được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn;

R^2 được chọn từ H, halogen, và C_1 - C_6 -alkyl;

R^3 được chọn từ H, halogen, và C_1 - C_6 -alkyl;

Ar là pyridinyl hoặc thiophenyl được thế bằng R^{Ar} khi $S(=O)_mR^e$ ở vị trí ortho để liên kết nối với heteroaryl 9 cạnh của hợp chất có công thức I, và tùy ý được thế tiếp bằng 1 R^{Ar} được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, phenyl, và benzyl, trong đó vòng phenyl của R^{Ar} không được thế hoặc được thế bằng các gốc R^f ;

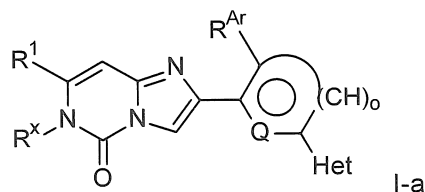
R^e được chọn từ C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, và C_3 - C_6 haloxycloalkyl;

R^f được chọn từ halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_3 - C_6 -xycloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, và C_2 - C_6 -alkynyl, mà không được thế hoặc được thế bằng halogen;

m bằng 0, 1, hoặc 2;

Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl; trong đó Het không được thể hoặc được thể bằng R; R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl.

7. Hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên, tương ứng với hợp chất có công thức I-a,



trong đó vòng tròn trên vòng chứa Q biểu thị rằng vòng này là vòng thơm;

Q là S hoặc N;

R^x là C₁-C₆-alkyl;

R¹ được chọn từ C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, và C₁-C₆-alkylsulfonyl được halogen hóa một phần hoặc hoàn toàn

R^{Ar} là S(=O)_mR^e; trong đó

R^e là C₁-C₆-alkyl;

Het được chọn từ thiophenyl, oxazolidinyl, imidazolidinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, pyridinyl, oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, và thiadiazolyl; trong đó Het không được thể hoặc được thể bằng R;

R được chọn từ halogen, oxo (=O), C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, và C₁-C₆-alkoxycarbonyl;

m bằng 0, 1, hoặc 2;

o bằng 1 hoặc 2,

8. Chế phẩm chứa hợp chất có công thức I, như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7, N-oxit hoặc muối của chúng có thể chấp nhận được trong nông nghiệp.
9. Chế phẩm theo điểm 8, còn chứa thêm hoạt chất khác.
10. Phương pháp phi điều trị để chống lại hoặc phòng trừ sinh vật gây hại không xương sống, trong đó phương pháp này bao gồm bước cho sinh vật gây hại này hoặc nguồn thức ăn, môi trường sống hoặc nơi sinh đẻ của chúng tiếp xúc với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt sinh vật gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7 hoặc chế phẩm theo điểm 8 hoặc 9.
11. Phương pháp bảo vệ thực vật đang sinh trưởng tránh khỏi sự tấn công hoặc phá hoại bởi các sinh vật gây hại không xương sống, trong đó phương pháp này bao gồm bước cho thực vật, hoặc đất hoặc nước mà thực vật đang sinh trưởng ở đó tiếp xúc với một lượng có tác dụng diệt sinh vật gây hại của ít nhất một hợp chất có công thức I theo điểm bất kỳ trong số các điểm 1 đến 7 hoặc chế phẩm theo điểm 8 hoặc 9.
12. Hạt chứa hợp chất có công thức I, như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 7, hoặc các chất đồng phân đối ảnh, các chất đồng phân không đối quang hoặc các muối của chúng, hoặc chế phẩm, như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm 8 hoặc 9, với lượng nằm trong khoảng từ 0,1 g đến 10 kg trên 100 kg hạt.