

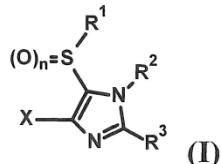


(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ  
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)   
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ  
(51)<sup>7</sup> C07D 471/04; A01P 17/00; C07D 1-0036505  
487/04; A01N 43/90; C07D 401/04 (13) B

- 
- (21) 1-2019-04279 (22) 03/01/2018  
(86) PCT/EP2018/050117 03/01/2018 (87) WO2018/130443 19/07/2018  
(30) 17150794.0 10/01/2017 EP  
(45) 25/07/2023 424 (43) 25/10/2019 379A  
(73) 1. BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)  
Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany  
2. Bayer Cropscience Aktiengesellschaft (DE)  
Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany  
(72) WILCKE, David (DE); HAGER, Dominik (DE); HOFFMEISTER, Laura (DE);  
KAUSCH-BUSIES, Nina (DE); MOSRIN, Marc (FR); WILLOT, Matthieu (FR);  
FISCHER, Rüdiger (DE); ILG, Kerstin (DE); GÖRGENS, Ulrich (DE); TURBERG,  
Andreas (DE).  
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)
- 

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG LÀM CHẤT PHÒNG TRỪ SINH VẬT GÂY HẠI, CHẾ  
PHẨM HÓA NÔNG CHÚA CHÚNG, PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ ĐỘNG VẬT  
GÂY HẠI, VÀ SẢN PHẨM CHÚA HỢP CHẤT HOẶC CHẾ PHẨM HÓA NÔNG  
CỦA CHÚNG

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



trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, và n có nghĩa như được nêu trong bản mô tả, chế phẩm hóa nông  
chứa chúng, và phương pháp phòng trừ động vật gây hại.

## **Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập**

Sáng chế đề cập đến các hợp chất dị vòng có công thức (I), chế phẩm hóa nông chúa chúng, phương pháp phòng trừ động vật gây hại, cụ thể là động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng và động vật thuộc lớp nhện, và các phương pháp và hợp chất trung gian để điều chế các hợp chất này.

## **Tình trạng kỹ thuật của sáng chế**

Các dẫn xuất dị vòng có đặc tính diệt côn trùng đã được mô tả trong các tài liệu chuyên ngành, ví dụ, trong WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/180193, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, WO 2016/124563, WO 2016/124557, WO 2015/121136, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2016/039441, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/039444, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286, WO 2016/046071, WO 2016/058928, WO 2016/059145, WO 2016/071214, WO 2016/091731, WO 2016/096584, WO 2016/107742, WO 2016/107831, WO 2016/113155, WO 2016/116338, WO 2016/121997, WO 2016/125621, WO 2016/125622, WO 2016/129684, WO 2016/142326, WO 2016/142327, WO 2016/169882 và WO 2016/169886.

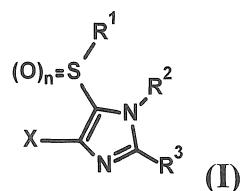
Các chế phẩm bảo vệ cây trồng hiện đại cần phải đáp ứng nhiều yêu cầu, ví dụ, liên quan đến phạm vi, độ tồn dư và phổ tác dụng và mục đích sử dụng có thể của chúng. Các vấn đề về độc tính, bảo tồn các loài có lợi và thực vật thụ phấn, các đặc tính môi trường, tỷ lệ áp dụng, khả năng kết hợp với các thành phần hoạt tính khác hoặc các chất phụ trợ phối chế đóng vai trò quan trọng, như vấn đề về tính phức tạp liên quan đến quá trình tổng hợp thành phần hoạt tính và tính kháng cũng có thể xuất hiện, để đề cập tới chỉ một vài thông số. Vì tất cả những lý do này, vấn đề tìm kiếm chế phẩm bảo vệ cây trồng mới không thể được coi là hoàn thành và vẫn luôn có nhu cầu về các hợp chất mới có các đặc tính được cải thiện hơn các hợp chất đã biết, ít nhất về từng khía cạnh riêng biệt.

## Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là để xuất các hợp chất mà mở rộng phổ tác dụng của các chất diệt sinh vật gây hại ở nhiều khía cạnh khác nhau và/hoặc cải thiện hoạt tính của chúng.

Các dẫn xuất dị vòng mới hiện đã được phát hiện, các hợp chất này có ưu điểm hơn so với các hợp chất đã biết, ví dụ bao gồm các đặc tính sinh học hoặc môi trường tốt hơn, nhiều phương pháp áp dụng hơn, tác động diệt côn trùng hoặc trừ nhện tốt hơn, và khả năng tương hợp tốt với cây trồng. Các dẫn xuất dị vòng này có thể được sử dụng kết hợp với các chế phẩm khác để cải thiện hiệu lực, đặc biệt là hiệu lực chống lại các côn trùng mà khó phòng trừ.

Do đó, đối tượng của sáng chế là các hợp chất có công thức (I)



trong đó (câu hình 1-1)

R<sup>1</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl,

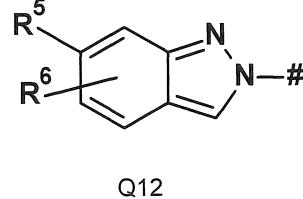
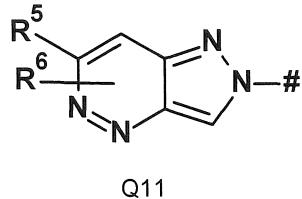
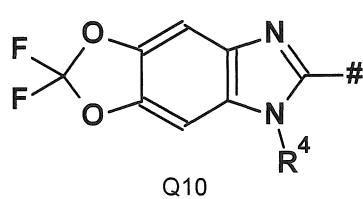
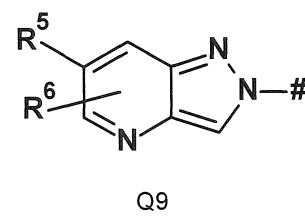
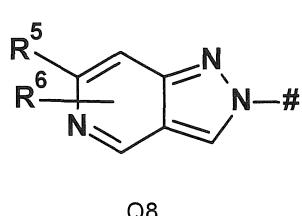
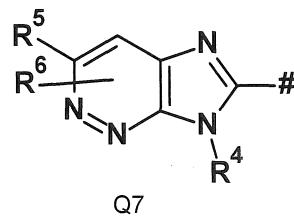
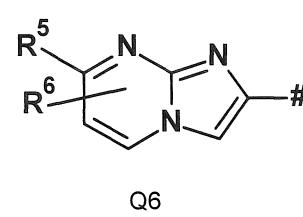
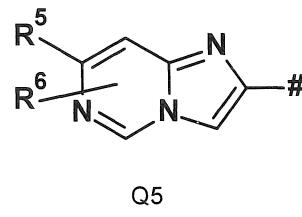
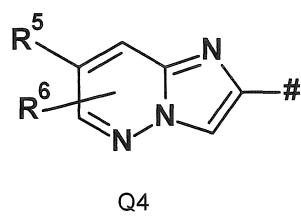
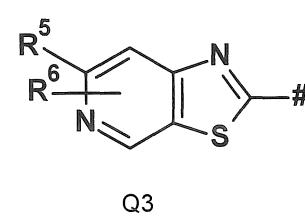
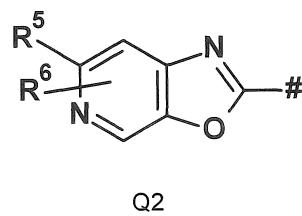
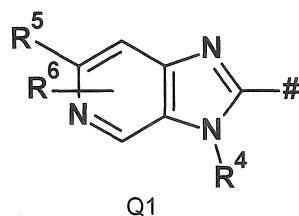
R<sup>3</sup> là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN,

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl,

hoặc là aryl hoặc hetaryl, mỗi nhóm này tùy ý được thể một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsilyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl,

C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, halo hetaryl, halooxohetaryl, xyano hetaryl, xyano oxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q12



R<sup>4</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-

(C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> độc lập là hydro, xyano, halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, xyano-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxyimino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl hoặc di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

### Mô tả chi tiết sáng chế

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình 1-1, trong đó nếu X là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl.

### Cấu hình 1-2

R<sup>1</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl,

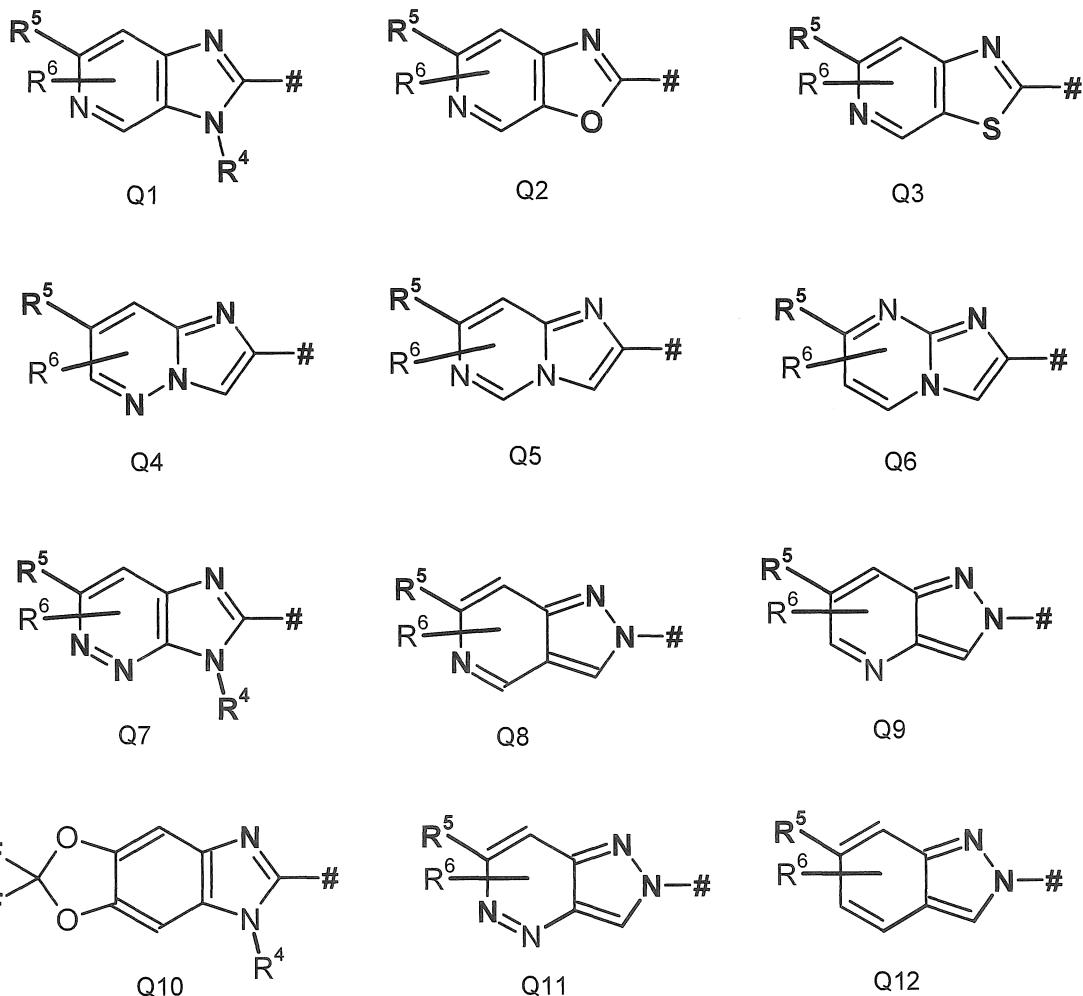
xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl,

R<sup>3</sup> là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino,

hoặc là aryl, hetaryl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thê có thê trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsilyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino,

(C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, halo hetaryl, halooxohetaryl, xyanohetaryl, xyano oxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q12



$R^4$  là hydro, ( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkyl, ( $C_1-C_6$ )xyanoalkyl, ( $C_1-C_6$ )hydroxyalkyl, ( $C_1-C_6$ )alkoxy-( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkoxy-( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_2-C_6$ )alkenyl, ( $C_2-C_6$ )alkenyloxy-( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_2-C_6$ )haloalkenyloxy-( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_2-C_6$ )haloalkenyl, ( $C_2-C_6$ )xyanoalkenyl, ( $C_2-C_6$ )alkynyl, ( $C_2-C_6$ )haloalkynyl hoặc ( $C_3-C_8$ )xycloalkyl,

$R^5, R^6$  độc lập là hydro, xyano, halogen, ( $C_1-C_6$ )alkyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkyl, ( $C_2-C_6$ )alkenyl, ( $C_2-C_6$ )haloalkenyl, ( $C_2-C_6$ )alkynyl, ( $C_2-C_6$ )haloalkynyl, ( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, ( $C_3-C_8$ )xycloalkyl-( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, ( $C_1-C_6$ )alkyl-( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkyl-( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, xyano-( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, halo( $C_3-C_8$ )xycloalkyl, ( $C_1-C_6$ )alkoxy, ( $C_1-C_6$ )haloalkoxy, ( $C_1-C_6$ )alkoxyimino, ( $C_1-C_6$ )haloalkoxyimino ( $C_1-C_6$ )alkylthio, ( $C_1-C_6$ )haloalkylthio, ( $C_1-C_6$ )alkylsulfinyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkylsulfinyl, ( $C_1-C_6$ )alkylsulfonyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkylsulfonyl, ( $C_1-C_6$ )alkylsulfonyloxy, ( $C_1-C_6$ )haloalkylsulfonyloxy, ( $C_1-C_6$ )alkylcarbonyl, ( $C_1-C_6$ )haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, ( $C_1-C_6$ )alkylaminocarbonyl, di( $C_1-C_6$ )alkylaminocarbonyl, ( $C_1-C_6$ )alkylsulfonylamino, ( $C_1-C_6$ )alkylamino, di( $C_1-C_6$ )alkylamino, aminosulfonyl, ( $C_1-C_6$ )alkylaminosulfonyl hoặc di( $C_1-C_6$ )alkylaminosulfonyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 1-2, trong đó nếu X là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl.

Ngoài ra cũng đã phát hiện ra rằng các hợp chất có công thức (I) có hiệu lực rất tốt làm chất diệt sinh vật gây hại, tốt hơn là làm chất diệt côn trùng và/hoặc chất diệt ve bét, và nói chung còn có khả năng tương hợp rất tốt với thực vật, đặc biệt là với cây trồng.

Các hợp chất theo sáng chế được xác định theo thuật ngữ chung bằng công thức (I). Các phân tử thê hoặc phạm vi của các gốc được ưu tiên được đưa ra trong các công thức nêu trên và dưới đây được minh họa sau đây:

#### Câu hình 2-1

R<sup>1</sup> tốt hơn nếu là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> tốt hơn nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl,

R<sup>3</sup> tốt hơn nếu là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl,

C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl,

hoặc tốt hơn nếu là aryl hoặc hetaryl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thê có thê trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsilyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, haloletaryl, halooxohetaryl, xyanohetaryl, xyanooxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X tốt hơn nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm từ Q1 đến Q12,

R<sup>4</sup> tốt hơn nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> tốt hơn nếu độc lập với nhau là hydro, xyano, halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl,

n tốt hơn nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 2-1, trong đó nếu X tốt hơn là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl.

## Câu hình 2-2

R<sup>1</sup> tốt hơn nếu là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> tốt hơn nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl,

(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl,

R<sup>3</sup> tốt hơn nếu là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino,

hoặc tốt hơn nếu là aryl, hetaryl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thê có thê trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsilyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, halo hetaryl, halooxohetaryl, xyano hetaryl, xyano oxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X tốt hơn nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm từ Q1 đến Q12,

R<sup>4</sup> tốt hơn nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> tốt hơn nếu độc lập với nhau là hydro, xyano, halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl

(C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl,

n tốt hơn nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 2-2, trong đó nếu X tốt hơn là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl.

### Câu hình 3-1

- R<sup>1</sup> tốt hơn nữa nếu là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,
  - R<sup>2</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl hoặc halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,
  - R<sup>3</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, halogen, xyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl,
- hoặc tốt hơn nữa nếu là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, furanyl, pyrazolyl, thiazolyl, oxazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SF<sub>5</sub>, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl,

- (C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino,
- X tốt hơn nữa nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm bao gồm Q1, Q2, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11 hoặc Q12,
- R<sup>4</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,
- R<sup>5</sup> tốt hơn nữa nếu là halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl,

R<sup>6</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

n tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 3-1, trong đó nếu X tốt hơn là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy.

### Câu hình 3-2

R<sup>1</sup> tốt hơn nữa nếu là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl hoặc halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>3</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, halogen, xyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl,

hoặc tốt hơn nữa là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, furanyl, pyrazolyl, thiazolyl, oxazolyl, imidazolyl, pyrrolyl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thể một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau, trong đó (trong trường hợp hetaryl) ít nhất một nhóm carbonyl có thể tùy ý có mặt và trong đó các phần tử thể có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SF<sub>5</sub>, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-

(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino,

X tốt hơn nữa nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm bao gồm Q1, Q2, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11 hoặc Q12,

R<sup>4</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>5</sup> tốt hơn nữa nếu là halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl,

R<sup>6</sup> tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

n tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình 3-2, trong đó nếu X tốt hơn là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, halogen, xyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy.

Cấu hình 4-1

R<sup>1</sup> thậm chí tốt hơn nữa nếu là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, cyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafoetyl,

R<sup>2</sup> thậm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, cyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, cyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafoetyl,

R<sup>3</sup> thậm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl,

hoặc thậm chí tốt hơn nữa nếu là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, thiazolyl, oxazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino,

X thậm chí tốt hơn nữa nếu là Q1, Q4, Q5, Q7, Q8, Q9 hoặc Q11,

- R<sup>4</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymethyl hoặc metoxyethyl,
- R<sup>5</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentaflometyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,
- R<sup>6</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, methyl, triflometyl, flo hoặc clo,
- n thàm chí tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình 4-1, trong đó nếu X thàm chí tốt hơn nữa là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl.

#### Cấu hình 4-2

- R<sup>1</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, cyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentaflometyl,
- R<sup>2</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, cyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, cyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentaflometyl,
- R<sup>3</sup> thàm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, halogen, xyano, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl,

hoặc thàm chí tốt hơn nữa là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, thiazolyl, oxazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl, cyclopentenyl hoặc cyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino,

hoặc thậm chí tốt hơn nữa nếu là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, halogen, nitro, hydroxyl, amino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, aminocarbonyl,

X      thậm chí tốt hơn nữa nếu là Q1, Q4, Q5, Q7, Q8, Q9, Q11 hoặc Q12,

R<sup>4</sup>    thậm chí tốt hơn nữa nếu là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymethyl hoặc methoxyethyl,

R<sup>5</sup>    thậm chí tốt hơn nữa nếu là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,

R<sup>6</sup>    thậm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, methyl, triflometyl, flo hoặc clo,

n      thậm chí tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 4-2, trong đó nếu X thậm chí tốt hơn nữa là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, halogen, xyano hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl.

#### Câu hình 4-3

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 4-2 và

X      thậm chí tốt hơn nữa nếu là Q1, Q7, Q8, Q9 hoặc Q12 và

R<sup>3</sup>    đặc biệt là hydro, flo, clo, brom, xyano, methyl, etyl, isopropyl, etenyl,

isopropenyl, cyclopropylmethyl, cyclopropyletyl, cyclopropyletenyl, cyclopropyletnyl, metoxycarbonyl, etoxycarbonyl, triflomethylaminocarbonyl, trifloetylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, etylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl, dimethylaminothiocarbonyl, etylaminothiocarbonyl,

hoặc là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, thiazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrolyl hoặc cyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, flo, clo, methyl, etyl, isopropyl, cyclopropyl, xyanometyl, xyanoethyl, xyanoisopropyl, xyanocyclopropyl, triflomethyl, trifloetyl, aminocarbonyl,

hoặc là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần bằng flo hoặc clo - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 4-3, trong đó nếu X thậm chí tốt hơn nữa là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, flo, clo, brom, xyano, methyl, etyl hoặc isopropyl.

### Câu hình 5-1

R<sup>1</sup> với sự nhấn mạnh là etyl hoặc isopropyl,

R<sup>2</sup> với sự nhấn mạnh là methyl, etyl hoặc isopropyl,

R<sup>3</sup> với sự nhấn mạnh là hydro, brom, xyano, etenyl, cyclopropyletenyl, isopropenyl, cyclopropyletnyl, methyl, etyl, isopropyl, cyclopropyletyl, metoxycarbonyl, trifloetylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, etylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl, dimethylaminothiocarbonyl,

hoặc với sự nhấn mạnh là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl (thienyl), thiazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrolyl hoặc cyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, flo, clo, methyl, cyclopropyl, xyanometyl, xyanoisopropyl, xyanocyclopropyl, triflomethyl, trifloetyl, aminocarbonyl,

hoặc với sự nhán mạnh là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần bằng clo - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử,

X với sự nhán mạnh là Q1, Q7, Q8, Q9 hoặc Q12,

R<sup>4</sup> với sự nhán mạnh là methyl,

R<sup>5</sup> với sự nhán mạnh là triflometyl,

R<sup>6</sup> với sự nhán mạnh là hydro,

n với sự nhán mạnh bằng 0 hoặc 2.

Theo một phuong án khác, sáng ché đê xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 5-1, trong đó nếu X là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, brom, xyano, methyl, etyl hoặc isopropyl.

### Câu hình 5-2

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, n có nghĩa được xác định trong câu hình 5-1 và

R<sup>3</sup> với sự nhán mạnh là hydro, brom, xyano, etenyl, xyclopropyletenyl, isopropenyl, xyclopropyletynyl, methyl, etyl, isopropyl, xyclopropyletyl, metoxycarbonyl, trifloethylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, etylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl, dimethylaminothiocarbonyl,

hoặc là phenyl, pyridin-2-yl, pyridin-3-yl, pyridin-4-yl, pyrimidin-5-yl, pyridazin-4-yl, thien-2-yl, thien-3-yl, 1,3-thiazol-5-yl, 1H-imidazol-1-yl, 1H-imidazol-2-yl, 1H-imidazol-5-yl, 1H-pyrazol-1-yl, 1H-pyrazol-3-yl, 1H-pyrazol-4-yl, 1H-pyrazol-5-yl, 1H-pyrol-2-yl hoặc 1-xcyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần, hai lần hoặc ba lần bằng các phân tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phân tử thê có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, flo, clo, methyl, xyclopropyl, xyanomethyl, xyanoisopropyl, xyanocylopropyl, triflometyl, trifloetyl, aminocarbonyl.

Theo một phuong án khác, sáng ché đê xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong câu hình 5-2, trong đó nếu X là Q7, thì R<sup>3</sup> không phải là hydro, brom, xyano, methyl, etyl hoặc isopropyl.

### Câu hình 5-3

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, n có nghĩa được xác định trong câu hình 5-1 và

$R^3$  với sự nhán mạnh là hydro, brom, xyano, etenyl, cyclopropyletenyl, isopropenyl, cyclopropyletnyl, methyl, ethyl, isopropyl, cyclopropylethyl, metoxycarbonyl, trifloetylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, ethylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl, dimethylaminothiocarbonyl,

phenyl, trong mỗi trường hợp tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần giống nhau hoặc khác nhau bằng xyano, flo, clo, methyl, xyanomethyl, xyanoisopropyl, xyanocyclopropyl, triflomethyl hoặc aminocarbonyl,

pyridin-2-yl, pyridin-3-yl hoặc pyridin-4-yl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần bằng flo hoặc clo,

pyrimidin-5-yl,

pyridazin-4-yl,

thien-2-yl hoặc thien-3-yl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng clo,

1,3-thiazol-5-yl, tùy ý được thế một lần bằng methyl,

1H-imidazol-1-yl, 1H-imidazol-2-yl hoặc 1H-imidazol-5-yl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng clo hoặc methyl,

1H-pyrazol-1-yl, 1H-pyrazol-3-yl, 1H-pyrazol-4-yl hoặc 1H-pyrazol-5-yl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần giống nhau hoặc khác nhau bằng clo, methyl, cyclopropyl, triflomethyl hoặc trifloetyl,

1H-pyrol-2-yl, trong mỗi trường hợp tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng methyl hoặc xyano,

1-xyclohexenyl, trong mỗi trường hợp tùy ý được thế một lần hoặc hai lần giống nhau hoặc khác nhau bằng methyl hoặc triflomethyl.

Theo một phương án khác, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  và n có nghĩa được xác định trong cấu hình 5-3, trong đó nếu X là Q7, thì  $R^3$  không phải là hydro, brom, xyano, methyl, ethyl hoặc isopropyl.

Nếu  $R^3$  là hetaryl được thế, thì việc thế trên nhóm hetaryl có thể là bằng cách thế hydro trên nguyên tử cacbon và/hoặc trên nguyên tử nitơ.

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q1 và  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1)

hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q1, R<sup>4</sup> là methyl, R<sup>5</sup> là triflometyl, R<sup>6</sup> là hydro và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q7 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q7, R<sup>4</sup> là methyl, R<sup>5</sup> là triflometyl, R<sup>6</sup> là hydro và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q8 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q8, R<sup>5</sup> là triflometyl, R<sup>6</sup> là hydro và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q9 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q9, R<sup>5</sup> là triflometyl, R<sup>6</sup> là hydro và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q12 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q12, R<sup>5</sup> là triflometyl, R<sup>6</sup> là hydro và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q1, Q7, Q8, Q9 hoặc Q12 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q1, Q8, Q9 hoặc Q12 và R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và R<sup>3</sup> có nghĩa được xác định trong cấu hình (5-1).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình

(5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và R<sup>3</sup> có nghĩa được xác định trong cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và R<sup>3</sup> có nghĩa được xác định trong cấu hình (5-3).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và

R<sup>3</sup> là hydro, brom, xyano, etenyl, xyclopropyletenyl, isopropenyl, xyclopropyletnyl, methyl, ethyl, isopropyl, xyclopropylethyl, metoxycarbonyl, trifloetylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, ethylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl hoặc dimethylaminothiocarbonyl.

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và

R<sup>3</sup> là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl (thienyl), thiazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrrolyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế có thể trong mỗi trường hợp là như sau: xyano, flo, clo, methyl, xyclopropyl, xyanomethyl, xyanoisopropyl, xyanocylopropyl, triflometyl, trifloetyl, aminocarbonyl.

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và

$R^3$  là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần bằng clo - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử.

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó  $R^2$ ,  $R^3$ , X,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và  $R^1$  là etyl.

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I), trong đó  $R^2$ ,  $R^3$ , X,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  và n có nghĩa được xác định trong cấu hình (1-1) hoặc cấu hình (1-2) hoặc cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (2-2) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (3-2) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (4-2) hoặc cấu hình (4-3) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2) hoặc cấu hình (5-3) và  $R^1$  là isopropyl.

Trong các định nghĩa được liệt kê nói chung hoặc trong các phạm vi ưu tiên, trừ khi có chỉ dẫn khác, halogen được chọn từ nhóm bao gồm flo, clo, brom và iod, tốt hơn nếu lần lượt từ nhóm bao gồm flo, clo và brom.

Aryl (kể cả dưới dạng một phần của đơn vị lớn hơn, ví dụ, arylalkyl), trừ khi được định nghĩa khác ở đâu đó nữa, được chọn từ nhóm phenyl, naphtyl, anthryl, phenanthrenyl, và tốt hơn nữa là phenyl.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, trừ khi được định nghĩa khác ở đâu đó nữa, thuật ngữ "alkyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ, haloalkyl, được hiểu với nghĩa là gốc của nhóm hydrocarbon béo no có 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể phân nhánh hoặc không phân nhánh. Ví dụ về các gốc C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-alkyl là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodecyl. Trong số các gốc alkyl này, ưu tiên cụ thể đối với các gốc C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl. Ưu tiên đặc biệt đối với các gốc C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.

Theo sáng chế, trừ khi được định nghĩa khác ở đâu đó nữa, thuật ngữ "alkenyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu với nghĩa là gốc C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl và ưu tiên cụ thể đối với các gốc C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl.

Theo sáng chế, trừ khi được định nghĩa khác ở đâu đó nữa, thuật ngữ "alkynyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu với nghĩa là gốc C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkynyl và ưu tiên cụ thể đối với các gốc C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alkynyl. Gốc alkynyl cũng có thể chứa ít nhất một liên kết đôi.

Theo sáng chế, trừ khi được định nghĩa khác ở đâu đó nữa, thuật ngữ "xycloalkyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu với nghĩa là gốc C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-xycloalkyl, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-xycloalkyl.

Thuật ngữ "alkoxy", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ, haloalkoxy, trong trường hợp này được hiểu với nghĩa là gốc O-alkyl, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được định nghĩa trên đây.

Các gốc được thế halogen, ví dụ, haloalkyl, được halogen hóa một lần hoặc nhiều lần, lên đến số lượng các phần tử thế có thể tối đa. Trong trường hợp halogen hóa nhiều lần, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau. Halogen ở đây là flo, clo, brom hoặc iod, đặc biệt là flo, clo hoặc brom.

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

Các định nghĩa hoặc các công thức minh họa của các gốc được đưa ra trên đây theo các thuật ngữ chung hoặc được liệt kê trong các phạm vi ưu tiên áp dụng tương ứng cho các sản phẩm cuối và các nguyên liệu ban đầu và các hợp chất trung gian. Các định nghĩa về các gốc này có thể được kết hợp với nhau nếu muốn, tức là bao gồm các tổ hợp nằm trong các phạm vi ưu tiên tương ứng.

Theo sáng chế, ưu tiên đối với việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp các nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên.

Theo sáng chế, ưu tiên cụ thể đối với việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp các nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên cụ thể.

Theo sáng chế, ưu tiên rất cụ thể đối với việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên rất cụ thể.

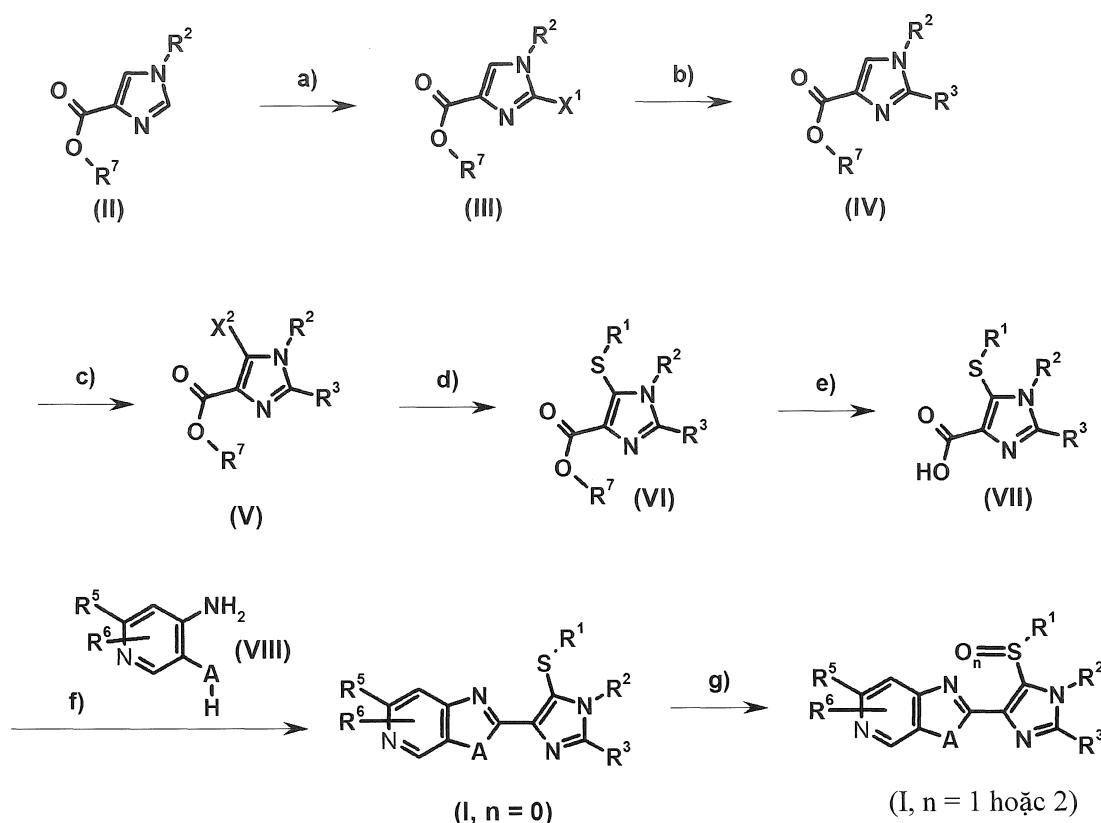
Theo sáng chế, ưu tiên nhất đối với việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) mà chứa tổ hợp các nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên nhất.

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

Các hợp chất theo sáng chế có công thức (I) có thể thu được bằng các quy trình được thể hiện trong các sơ đồ sau:

### Phương pháp A

Phương pháp chung điều chế các hợp chất có công thức (I), trong đó R<sup>3</sup> là aryl, hetaryl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl – tùy ý được thể như được mô tả trên đây – và X là Q1, Q2, Q3, Q7 hoặc Q10, được mô tả dưới đây bằng các ví dụ về các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q1, Q2 hoặc Q3.



Các gốc R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> và R<sup>6</sup> có nghĩa được nêu trên đây. A là -N-R<sup>4</sup>, O hoặc S, trong đó R<sup>4</sup> có nghĩa được nêu trên đây. X<sup>1</sup> và X<sup>2</sup> là halogen. R<sup>7</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl.

### Bước a)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế từ các dẫn xuất imidazol có công

thúc (II), ví dụ, bằng cách cho phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như *N*-bromosucxinimit (NBS) trong dung môi như tetrahydrofuran chẳng hạn hoặc bằng cách cho các hợp chất có công thức (II) phản ứng với NBS kết hợp với azobis(isobutyronitril) (AIBN) trong tetraclometan hoặc clorofom, tương tự như các phương pháp được mô tả, ví dụ, trong WO2013/149997, WO2014/115077 hoặc WO2011/123609.

Các dẫn xuất imidazol có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO2014/191894, US2003/229079 hoặc WO2013/156608.

### Bước b)

Các hợp chất có công thức (III) trong đó X<sup>1</sup> tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, có thể được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (IV), ví dụ, bằng cách ghép đôi chéo qua trung gian kim loại chuyển tiếp [tham khảo *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004] hoặc bằng cách thế ái nhân vào vòng thơm (tham khảo các phương pháp được mô tả trong *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2007, 17, 5825-5830 hoặc US4125726).

Ví dụ, các hợp chất có công thức (III), trong đó X<sup>1</sup> tốt hơn là clo hoặc brom, có thể được cho phản ứng với các axit boronic [R<sup>3</sup>-B(OH)<sub>2</sub>] hoặc boronic este thích hợp bằng các phương pháp đã biết (tham khảo WO2012/143599, US2014/94474, US2014/243316, US2015/284358 hoặc *Journal of Organic Chemistry* 2004, 69, 8829-8835) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm các muối kim loại chuyển tiếp để thu được các hợp chất có công thức (IV). Ví dụ về các chất xúc tác ghép đôi được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II), bis(triphenylphosphin)paladi(II) diclorua hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất phụ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để tiến hành các phương pháp này tốt hơn là các cacbonat của natri, kali hoặc xesi. Một số dẫn xuất axit boronic [R<sup>3</sup>-B(OH)<sub>2</sub>] hoặc dẫn xuất boronic este cần thiết là đã biết và/hoặc có bán trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết thông thường (tham khảo *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011). Trong trường hợp này, tốt hơn là phản ứng này được thực hiện trong hỗn hợp gồm nước và dung môi hữu cơ được chọn từ các dung môi hữu cơ thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ete như tetrahydrofuran, dioxan hoặc 1,2-dimetoxyetan thường được sử dụng.

Theo cách khác, có thể sử dụng các dẫn xuất stanan [R<sup>3</sup>-Sn(Et)<sub>4</sub>] làm đối tác ghép đôi (tham khảo US2013/281433, WO2004/99177 hoặc WO2016/71214). Một số dẫn xuất stanan [R<sup>3</sup>-Sn(Et)<sub>4</sub>] cần thiết là đã biết và/hoặc có bán trên thị trường, hoặc chúng có

thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết thông thường (tham khảo WO2016/71214 hoặc WO2007/148093).

Việc ghép đôi dẫn xuất imidazol được halogen hóa có công thức (III) với các dị vòng thơm chứa NH như imidazol hoặc pyrazol, tùy ý được thể như được mô tả trên đây, để thu được các hợp chất có công thức (IV) có thể được thực hiện bằng phản ứng trong điều kiện bazơ (ví dụ, bằng natri hydrua trong dimetylformamat (tham khảo, ví dụ, WO2005/58898). Theo cách khác, phản ứng này có thể được thực hiện trong môi trường khí trơ bằng cách xúc tác bằng các muối đồng(I), đồng(I) iodua, ví dụ, với sự có mặt của phôi tử thích hợp, ví dụ, (*trans*)-N,N'-dimethylcyclohexan-1,2-diamin hoặc *R*-(+)-prolin, và bazơ thích hợp, ví dụ, kali cacbonat hoặc kali phosphat, trong dung môi thích hợp như 1,4-dioxan hoặctoluen (tham khảo, ví dụ, WO2016/109559). Trong các điều kiện phản ứng này, các hợp chất có công thức (IV) trong đó  $R^3 = H$  cũng có thể được tạo ra.

### Bước c)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (V), trong đó  $X^2$  tốt hơn là halogen từ nhóm brom hoặc iot, có thể được điều chế bằng các phương pháp chuẩn từ các hợp chất có công thức (IV) bằng cách cho phản ứng với, ví dụ, brom hoặc *N*-bromosucxinimic (NBS), (tham khảo WO2009/115572 hoặc WO2010/91411) hoặc *N*-iodosucxinimic (NIS), tùy ý có mặt axit axetic hoặc axit trifluoacetic (tham khảo WO2008/63287, WO2007/87548 hoặc WO2009/152025).

### Bước d)

Các hợp chất có công thức (V), trong đó  $X^2$  tốt hơn là halogen từ nhóm brom hoặc iot, có thể được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (VI), ví dụ, bằng cách cho phản ứng trong điều kiện bazơ với các dẫn xuất mercaptan ( $R^1-SH$ ) và các muối đồng(I) (tham khảo EP257918 hoặc WO2009/152025) hoặc bằng cách thải ái nhân vào vòng thơm (tham khảo *Australian Journal of Chemistry* 1987, 40, 1415-1425).

Theo cách khác, phản ứng của các hợp chất có công thức (V) trong đó  $X^2$  tốt hơn là halogen từ nhóm brom hoặc iot, với các dẫn xuất mercaptan ( $R^1-SH$ ) có thể được thực hiện với sự có mặt của chất xúc tác paladi như tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi [ $Pd_2(dbu)_3$ ]. Trong trường hợp này, thường sử dụng các bazơ amin như trietylamin hoặc *N,N*-diisopropylethylamin (DIPEA) và cả các phôi tử phosphin như Xantphos (tham khảo WO2013/25958, WO2013/66869, US2009/27039, WO2011/58149, WO2011/143466 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2016, 26, 2984-2987). Trong trường hợp này, tốt hơn là phản ứng này được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi hữu cơ thông thường mà trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với ete, ví dụ, dioxan hoặc 1,2-dimethoxyethane.

Các dẫn xuất mercaptan, ví dụ, methyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, *Chemical Communications*, 13 (2000), 1163-1164 hoặc *Journal of the American Chemical Society*, 44 (1922), pp. 1323-1333.

#### Bước e)

Este có công thức (VI) có thể được chuyển hóa thành axit carboxylic có công thức (VII) bằng các phương pháp chuẩn (tham khảo, ví dụ, WO2014/191894, US2006/194779, WO2014/86663 hoặc *European Journal of Organic Chemistry*, 2009, 213-222), ví dụ, bằng hydroxit kim loại kiềm bazơ, như natri hydroxit hoặc lithi hydroxit, trong rượu làm dung môi, ví dụ, metanol hoặc etanol.

#### Bước f)

Các hợp chất có công thức (I, n = 0) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (VII) bằng các hợp chất có công thức (VIII) với sự có mặt của thành phần ngưng tụ.

Các hợp chất có công thức (VIII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2015/000715, WO 2015/121136, WO2016/039441, WO2016/059145, WO2016/071214, WO 2016/169882, WO 2016/169886 hoặc WO2016/124557.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n = 0) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên tiến hành phản ứng trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với ete, ví dụ, diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, tert-butyl methyl ete; hydrocarbon được halogen hóa, ví dụ, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, 1,2-dichloroethane hoặc clobenzene; rượu như metanol, ethanol hoặc isopropanol; nitrile, ví dụ, acetonitrile hoặc propionitrile; hydrocarbon thơm, ví dụ, toluene hoặc xylen; dung môi không proton phản ứng, ví dụ, N,N-dimethylformamide hoặc N-methylpyrrolidone, hoặc các hợp chất nitro, ví dụ, pyridine.

Ví dụ về các thành phần ngưng tụ thích hợp là carbodiimide như 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide hydrochloride (EDCI) hoặc 1,3-dicyclohexylcarbodiimide; anhydrite như anhydrite axetic, anhydrite trifluoroacetic; hỗn hợp gồm triphenylphosphine, bazơ và carbon tetrachloride, hoặc hỗn hợp gồm triphenylphosphine và azo diester, ví dụ, axit diethylazodicarboxylic.

Phản ứng này có thể được thực hiện với sự có mặt của chất xúc tác thích hợp, ví dụ, 1-hydroxybenzotriazole.

Phản ứng này có thể được thực hiện với sự có mặt của axit hoặc bazơ.

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

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

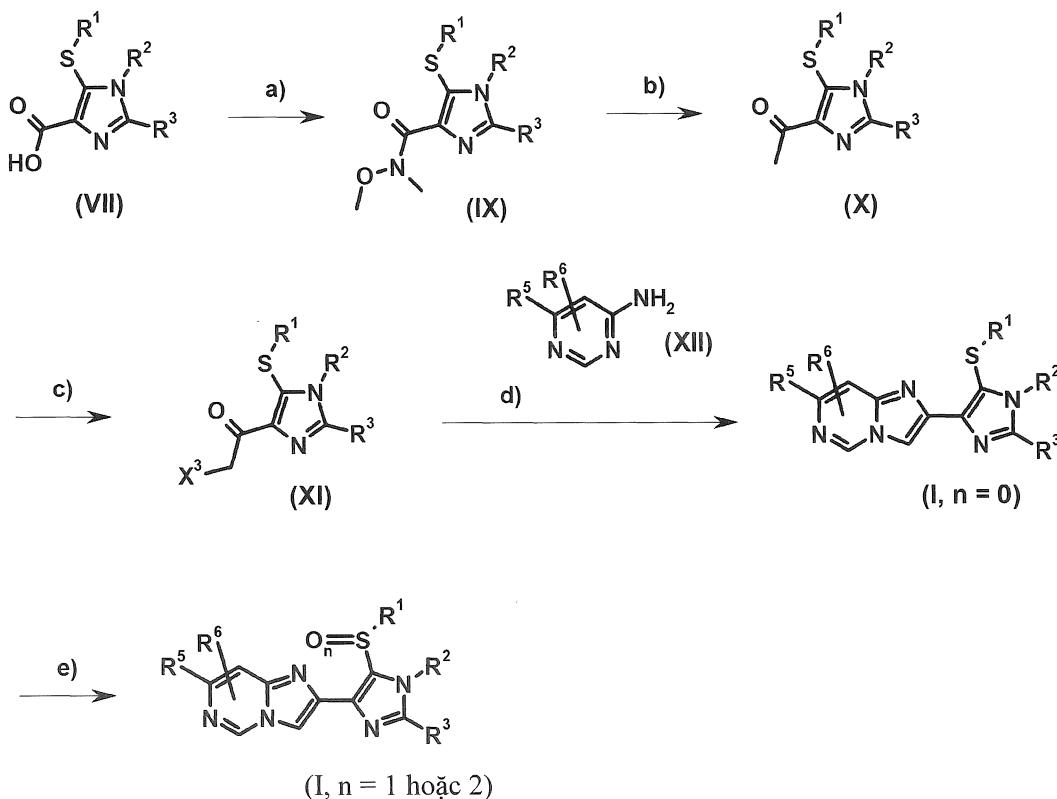
### Bước g)

Các hợp chất có công thức (I, n = 1 hoặc 2) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I, n = 0), ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong 2016/169882 hoặc WO 2016/124557. Quá trình oxy hóa nói chung được thực hiện trong dung môi. Ưu tiên đối với hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ, diclometan, clorofom, cacbon tetrachlorua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về thành phần oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit *meta*-cloperbenzoic.

### Phương pháp B

Phương pháp chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q4, Q5 hoặc Q6 được mô tả dưới đây bằng các ví dụ liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q5.



Các gốc  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  và  $R^6$  có nghĩa được nêu trên đây.  $X^3$  là halogen.

Bước a)

Các axit carboxylic có công thức (VII) có thể được chuyển hóa thành amit Weinreb có công thức (IX) với sự có mặt của *N,O*-dimethylhydroxylamin hydrochlorua với sự có mặt của thành phần ngưng tụ tương tự như các phương pháp được mô tả trong US9108905 hoặc *Organic Letters* 2009, 11 1023-1026.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (IX) tốt hơn là được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với các nitril, ví dụ, axetonitril hoặc propionitril, hoặc dung môi không proton phân cực, ví dụ, *N,N*-dimethylformamit hoặc *N*-metylpyrrolidon.

Ví dụ về các thành phần ngưng tụ thích hợp là carbodiimide như 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-etylcarbodiimide hydrochlorua (EDCI) và 1,3-dicyclohexylcarbodiimide, anhydrit như anhydrit axetic và anhydrit trifloaxetic hoặc isobutyl clorofomat.

Phản ứng này có thể được thực hiện với sự có mặt của bazơ, ví dụ, trietylamin hoặc *N*-methylmorpholin.

Bước b)

Amit Weinreb có công thức (IX) có thể được chuyển hóa thành xeton có công thức (X) với sự có mặt của metyllithi hoặc methylmagie halogenua, ví dụ, methylmagie bromua, tương tự như các phương pháp được mô tả trong *Journal of Medicinal Chemistry* 1995, 38, 4972-4975 hoặc *Organic Letters* 2012, 14 6158-6161.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (X) được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với ete, ví dụ, tetrahydrofuran hoặc dietyl ete.

#### Bước c)

Xeton có công thức (X) có thể được chuyển hóa thành enolat bằng cách khử proton bằng lithi diisopropylamit (LDA) trong tetrahydrofuran tương tự như các phương pháp được mô tả trong *Chemistry - A European Journal* 2011, 17, 4839-4848. Sau đó, enolat được tạo ra có thể được chuyển hóa thành silyl enol ete, ví dụ, bằng trimethylsilyl clorua (TMSCl), mà tiếp theo được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XI) bằng cách *alpha*-halogen hóa, ví dụ, bằng *N*-bromosuccinimit (NBS). Theo cách khác, bắt đầu từ xeton có công thức (X), cũng có thể sử dụng các phương pháp khác đã biết trong các tài liệu chuyên ngành để *alpha*-halogen hóa, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong US2006/52378, WO2005/7631, US2012/214791 hoặc US4544664.

#### Bước d)

Các hợp chất có công thức (I, n = 0) có thể được điều chế bằng cách đóng vòng các hợp chất có công thức (XI) bằng các amin có công thức (XII). Việc đóng vòng được thực hiện, ví dụ, trong etanol, axetonitril hoặc *N,N*-dimethylformamit bằng các phương pháp đã biết tương tự như các quy trình được mô tả, ví dụ, trong WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 hoặc *J. Med. Chem.* 1988 31 1590-1595.

Các hợp chất có công thức (XII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong US2009/170849, WO2016/51193, WO2016/107742 hoặc WO2016/71214.

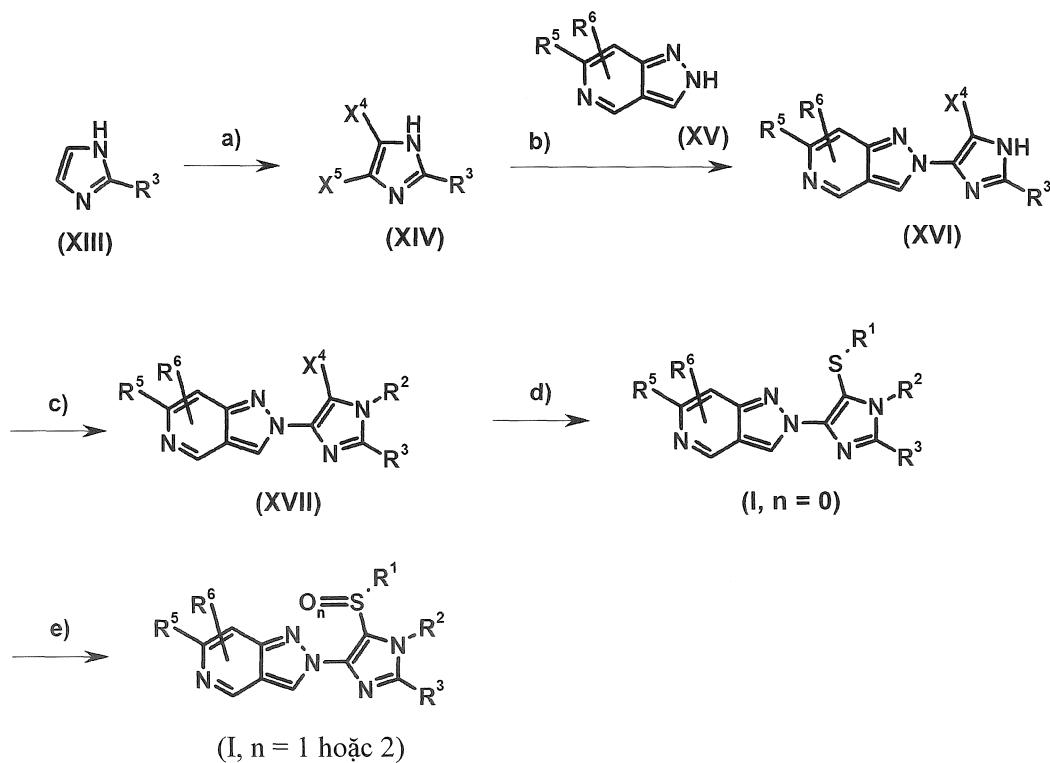
#### Bước e)

Các hợp chất có công thức (I, n = 0) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n = 1 hoặc 2) tương tự như phương pháp A, bước g).

### Phương pháp C

Phương pháp chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q8, Q9,

Q11 hoặc Q12 được mô tả dưới đây bằng các ví dụ liên quan đến các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q8.



Các gốc R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> và R<sup>6</sup> có nghĩa được nêu trên đây. X<sup>4</sup> và X<sup>5</sup> là halogen.

Trình tự của các bước b) đến e) có thể được thay đổi với nhau.

### Bước a)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XIII), tương tự như phương pháp A, bước a) và bước c), có thể được cho phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như NBS, brom hoặc iot để thu được các hợp chất có công thức (XIV) - trong đó X<sup>4</sup> và X<sup>5</sup> tốt hơn là halogen từ nhóm brom hoặc iot (tham khảo WO2011/85269, WO2004/80998 hoặc WO2016/87487).

Các hợp chất có công thức (XIII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong *Advanced Synthesis and Catalysis* **2009**, 351, 2912-2920; *Synthetic Communications* **1989**, 19, 2551-2566 hoặc WO2009/27746.

### Bước b)

Các hợp chất có công thức (XVI) có thể được tổng hợp từ các hợp chất có công thức (XIV) bằng cách cho phản ứng với các hợp chất có công thức (XV), ví dụ, bằng cách phản ứng trong điều kiện bazơ - ví dụ, bằng cách sử dụng các bazơ cacbonat như natri

cacbonat hoặc lithi cacbonat - trong dung môi không proton phân cực như *N,N*-dimetylformamit, tương tự như các phương pháp được mô tả trong *Bioorganic and Medicinal Chemistry* 2008, 16, 9524-9535; *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 1997, 7, 2723-2728 hoặc WO2016/20286.

Theo cách khác, phản ứng này có thể được thực hiện với sự có mặt của đồng hoặc đồng(I) iodua và chất phụ trợ phản ứng bazơ, như *trans-N,N'*-dimethylxyclohexan-1,2-diamin, kali cacbonat hoặc kali phosphat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO2016/20286 hoặc KR2015/66012. Các dung môi hoặc chất pha loãng hữu ích bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ, hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên sử dụngtoluen.

Các hợp chất có công thức (XV) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như phương pháp được mô tả trong *Organic Letters* 2011, 13, 3542-3545.

#### **Bước c)**

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XVI) có thể được chuyển hóa thành các dẫn xuất imidazol được thê ở vị trí *N* có công thức (XVII) bằng các phương pháp chuẩn (tham khảo, ví dụ, *Heterocycles* 1999, 50, 1081-1090; WO2009/70045 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2007, 17, 1369-1375) bằng cách cho phản ứng với các chất ái điện tử, các hợp chất chứa nhóm rời chuyển ( $R^2-LG$ ; LG = clo, brom, iot, O-triflat, O-mesyl), ví dụ, bằng cách sử dụng hydroxit kim loại kiềm như natri hydroxit hoặc kali hydroxit làm bazơ, trong rượu như etanol làm dung môi.

#### **Bước d)**

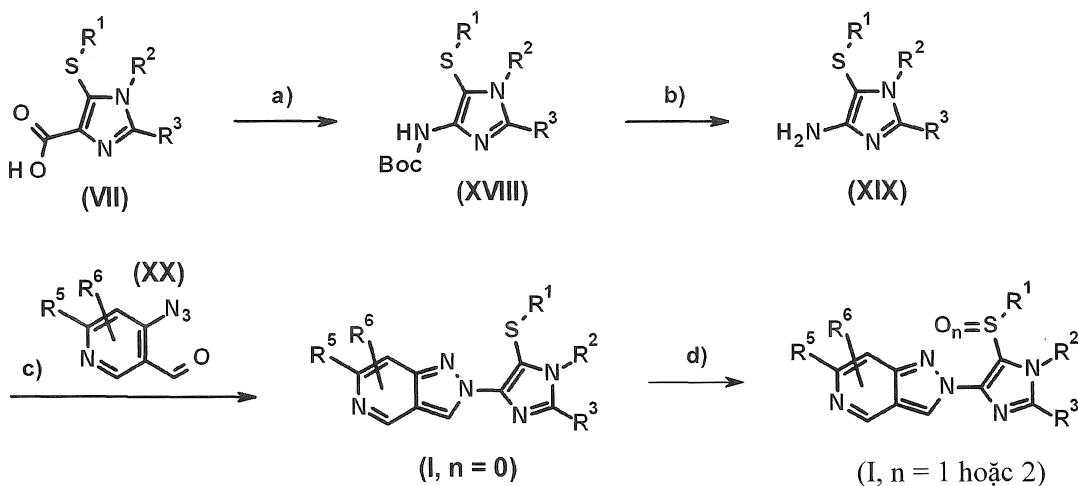
Các hợp chất có công thức (XVII) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n = 0) tương tự như phương pháp A, bước d).

#### **Bước e)**

Các hợp chất có công thức (I, n = 0) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n = 1 hoặc 2) tương tự như phương pháp A, bước g).

### **Phương pháp D**

Phương pháp chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q8, Q9, Q11 hoặc Q12 được mô tả dưới đây bằng các ví dụ liên quan đến các hợp chất có công thức (I), trong đó X là Q8.



Các gốc  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  và  $R^6$  có nghĩa được nêu trên đây. [Boc = *tert*-butyloxycarbonyl]

### Bước a)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XVIII) có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (VII) bằng cách cho phản ứng với diphenyl azidophosphat (DPPA) trong *tert*-butanol với sự có mặt của bazơ amin như triethylamin, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong US2012/149699, WO2011/112766 hoặc WO2009/23179.

### Bước b)

Các dẫn xuất imidazol được bảo vệ bằng *N*-Boc có công thức (XVIII) có thể được chuyển hóa thành các dẫn xuất imidazol có công thức (XIX) bằng các phương pháp chuẩn (tham khảo, ví dụ, WO2015/166289, US2008/9497 hoặc WO2006/77424) bằng cách sử dụng axit như axit clohydric hoặc axit trifloaxetic trong dung môi, ví dụ, 1,4-dioxan hoặc metanol.

### Bước c)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XIX) có thể được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n= 0) bằng cách cho phản ứng với các hợp chất có công thức (XX) bằng cách tạo imin (ví dụ, trongtoluen hoặc diclometan) và tiếp theo đóng vòng với việc sử dụng tùy ý axit như titan tetrachlorua hoặc titan isopropoxit, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO2012/66061 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2017, 27, 1593 - 1597.

Các hợp chất có công thức (XX) có thể được điều chế tương tự như các phương pháp đã biết trong các tài liệu chuyên ngành (xem, ví dụ, WO2015/116882,

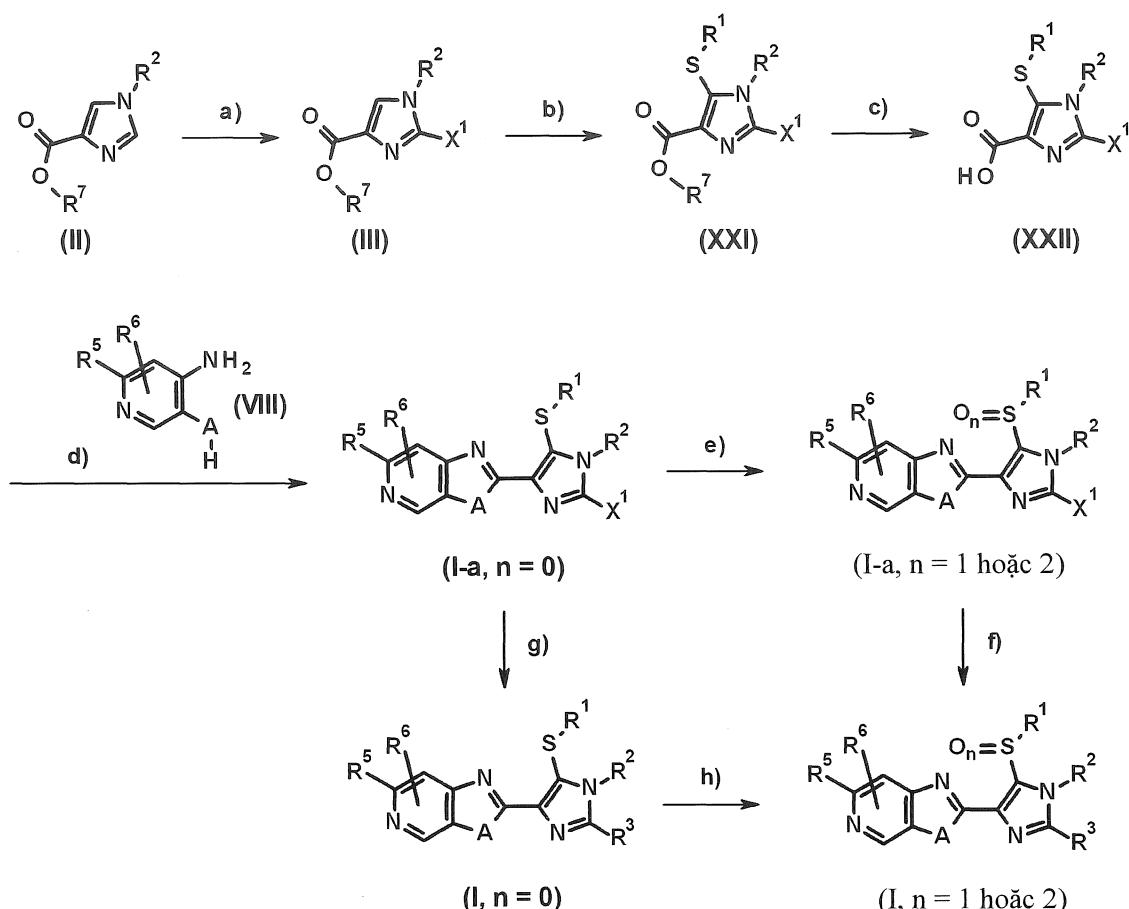
WO2017/75694, *Angewandte Chemie International Edition* 2011, 50, 1702-1706 hoặc *Organic Letters* 2010, 12, 2884-2887).

### Bước d)

Các hợp chất có công thức (I, n = 0) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I, n = 1 hoặc 2) tương tự như phương pháp A, bước g).

### Phương pháp E

Phương pháp chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q1, Q2, Q3, Q7 hoặc Q10 được mô tả dưới đây bằng các ví dụ liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q1, Q2 hoặc Q3.



Các gốc R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> và R<sup>6</sup> có nghĩa được nêu trên đây. A là -N-R<sup>4</sup>, O hoặc S, trong đó R<sup>4</sup> có nghĩa được nêu trên đây. X<sup>1</sup> là halogen. R<sup>7</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl.

### Bước a)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế từ các dẫn xuất imidazol có công

thúc (II), ví dụ, bằng cách cho phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như *N*-bromosucxinimit (NBS) chẳng hạn trong dung môi như tetrahydrofuran hoặc bằng cách cho các hợp chất có công thức (II) phản ứng với NBS kết hợp với azobis(isobutyronitril) (AIBN) trong tetraclometan hoặc clorofom, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO2013/149997, WO2014/115077 hoặc WO2011/123609.

Các dẫn xuất imidazol có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO2014/191894, US2003/229079 hoặc WO2013/156608.

#### **Bước b)**

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XXI) có thể được điều chế bằng các phương pháp chuẩn từ các hợp chất có công thức (III) bằng cách cho phản ứng với disulfua ( $R^1-S-S-R^1$ ) và, ví dụ, bazơ mạnh, tốt hơn là lithi diisopropylamit (LDA) trong tetrahydrofuran (tham khảo *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2010, 20, 1084 – 108) hoặc, ví dụ, hydro peroxit và iot trong etanol (tham khảo *Synthesis* 2015, 47, 659 - 671).

#### **Bước c)**

Các hợp chất có công thức (XXI) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XXII) tương tự như phương pháp A, bước e).

#### **Bước d)**

Các hợp chất có công thức (XXII) được cho phản ứng với các hợp chất có công thức (VIII) để thu được các hợp chất có công thức (Ia,  $X^1 = R^3 = \text{halogen}$ ,  $n = 0$ ) tương tự như phương pháp A, bước f).

#### **Bước e, h)**

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (I-a,  $n = 0$ ) thành các hợp chất có công thức (I-a,  $n = 1$  hoặc 2) và cả việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (I,  $n = 0$ ) thành các hợp chất có công thức (I,  $n = 1$  hoặc 2) được thực hiện tương tự như phương pháp A, bước g).

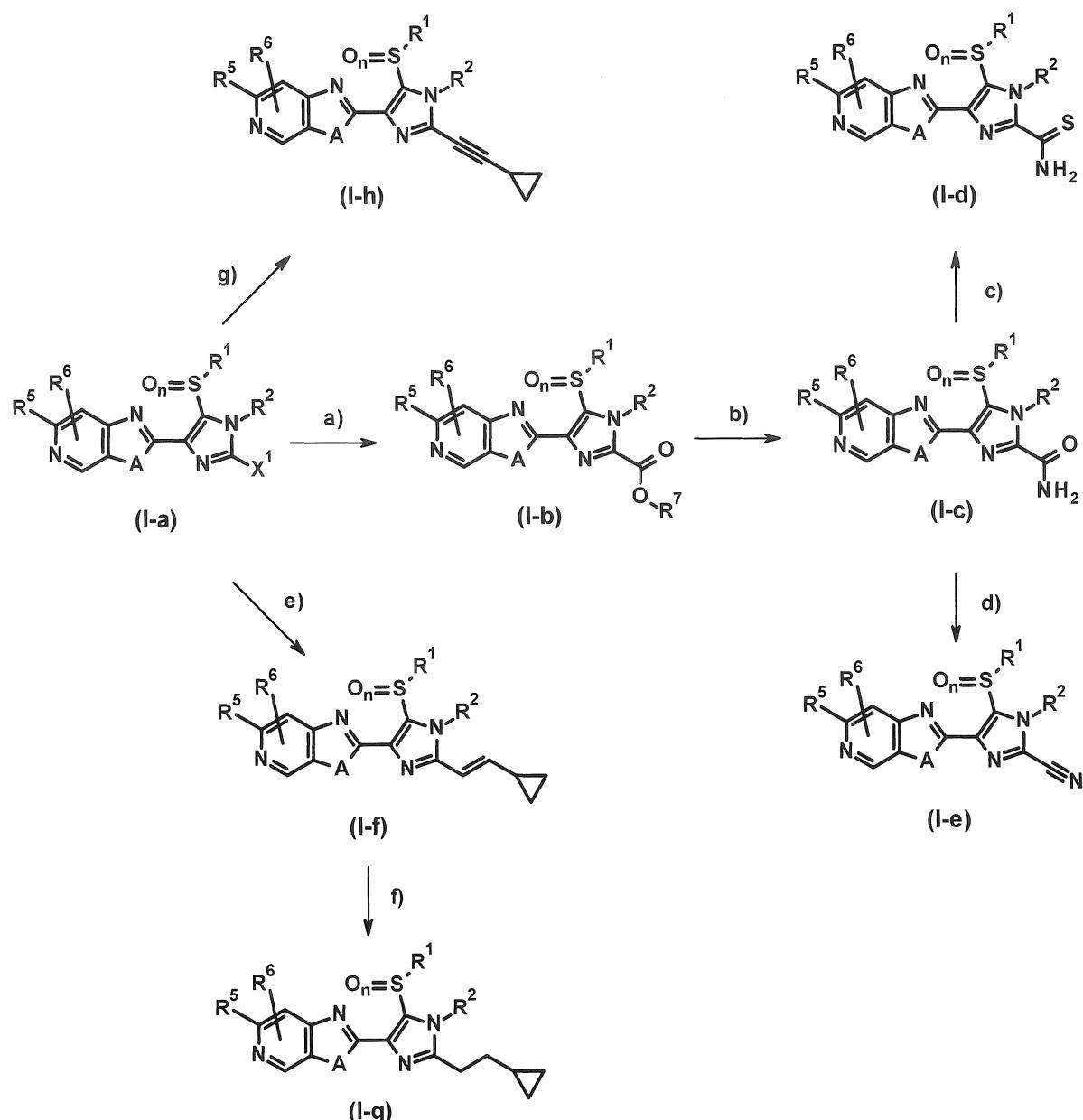
#### **Bước f, g)**

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (I-a,  $n = 0$ ) thành các hợp chất có công thức (I,  $n = 0$ ) và cả việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (I-a,  $n = 1$  hoặc 2) thành các hợp chất có công thức (I,  $n = 1$  hoặc 2) được thực hiện tương tự như phương pháp A, bước b).

Bắt đầu từ các hợp chất có công thức (XXII), các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được điều chế, tương tự như phương pháp B và thực hiện tiếp theo các bước e) -> f) hoặc g) -> h) của phương pháp E, trong đó X là Q4, Q5 hoặc Q6.

### Phương pháp F

Phương pháp chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R<sup>3</sup> là, bằng ví dụ minh họa, các nhóm chức được mô tả trên đây, được mô tả dưới đây bằng các ví dụ liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q1, Q2 hoặc Q3.



Các gốc R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup> và R<sup>6</sup> có nghĩa được nêu trên đây. A là -N-R<sup>4</sup>, O hoặc S, trong đó R<sup>4</sup> có nghĩa được nêu trên đây. X<sup>1</sup> là halogen. R<sup>7</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl. n bằng 0,1 hoặc 2.

### Bước a)

Các hợp chất có công thức (I-b) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (I-a) bằng cách cho phản ứng với cacbon monoxit theo các phương pháp đã biết trong các tài liệu chuyên ngành, ví dụ, bằng cách phản ứng trong rượu thích hợp (ví dụ, metanol hoặc etanol) và sự xúc tác bằng cách sử dụng chất xúc tác paladi như paladi(II) diclorua, tetrakis(triphenylphosphin)paladi hoặc bis(axetonitril)paladi(II) diclorua, với sự có mặt của phôi tử phosphin, ví dụ, triphenylphosphin, Xantphos [(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanten)] hoặc BINAP [2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthalen] và tùy ý có mặt bazơ thích hợp, trietylamin, ví dụ, [tham khảo, ví dụ, US2014/46072, WO2004/106293 hoặc *Journal of Medicinal Chemistry* 2009, 52, 2880 - 2898].

#### Bước b)

Các este có công thức (I-b) thu được có thể được chuyển hóa thành các amit tương ứng có công thức (I-c), ví dụ, bằng cách xà phòng hóa tương tự như phương pháp A, bước e) và hoạt hóa tiếp theo axit carboxylic bằng chất phản ứng ghép đôi như 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-etylcarbodiimid hydrochlorua (EDCI) [cũng xem phương pháp A, bước f)] hoặc bằng cách chuyển hóa thành axyl clorua và phản ứng với amin [tham khảo, ví dụ, WO2012/146666, US2014/315924 hoặc WO2005/4863].

Sự tạo thành amit có thể được thực hiện trực tiếp từ các este có công thức (I-b) bằng cách cho phản ứng với amin, ví dụ, trong metanol [tham khảo, ví dụ, WO2014/72261 hoặc US2013/338137], tùy ý có mặt bazơ như lithi bis(trimethylsilyl)amit (LHMDS) [tham khảo, ví dụ, WO2016/87487].

#### Bước c)

Các thioamit có công thức (I-d) có thể được điều chế từ các amit có công thức (I-c) bằng cách cho phản ứng với chất phản ứng lưu huỳnh hóa thích hợp, ví dụ, chất phản ứng Lawesson (tham khảo, tương tự, ví dụ, WO2005/9435) hoặc P4S10 (tham khảo, tương tự, ví dụ, European Journal of Medicinal Chemistry 1995 30, 915-924), trong các dung môi thích hợp, ví dụ,toluen hoặc xylen.

#### Bước d)

Các hợp chất có công thức (I-e) có thể được điều chế từ các amit bậc một có công thức [I-c, R<sup>3</sup> = -C(O)NH<sub>2</sub>] bằng cách cho phản ứng với thành phần ngưng tụ thích hợp, ví dụ, phospho oxychlorua (POCl<sub>3</sub>) hoặc phospho pentaclorua (PCl<sub>5</sub>), tùy ý trong dung môi thích hợp như dimetylformamit hoặc toluen (tham khảo, tương tự như, ví dụ, US2013/338137, WO2005/77950, WO2007/123516), hoặc theo cách khác, bằng anhydrit trifloaxetic trong dung môi thích hợp như, ví dụ, diclometan, tetrahydrofuran hoặc pyridin và tùy ý có mặt bazơ như trietylamin (tham khảo, tương tự như, ví dụ,

WO2014/198853 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2011, 21, 6515 - 6518).

### **Bước e)**

Các hợp chất có công thức (I-a) được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I-f) tương tự như phương pháp A, bước b).

### **Bước f)**

Các hợp chất có công thức (I-g) có thể được điều chế bằng các phương pháp chuẩn từ các hợp chất có công thức (I-f) trong dung môi (ví dụ, etyl axetat hoặc metanol) bằng cách sử dụng chất xúc tác hydro hóa (ví dụ, paladi trên cacbon hoặc platin dioxit) và phản ứng với hydro (tham khảo US2008/318935, US2011/275801 hoặc WO2015/91584).

### **Bước g)**

Các hợp chất có công thức (I-a) có thể được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I-f) tương tự như phương pháp A, bước b).

Theo cách khác, phản ứng này cũng có thể được thực hiện bằng cách sử dụng các dẫn xuất alkyn tận cùng, chất xúc tác paladi như bis(triphenylphosphin)paladi(II) diclorua hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi, đồng iodua và bazơ amin như trietylamin trong dung môi thích hợp như dimetylformamit (tham khảo, tương tự, ví dụ, WO 2002046166 hoặc *Organic & Biomolecular Chemistry* 2011, 9, 450-462).

### **Phương pháp và sử dụng**

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ động vật gây hại, trong đó các hợp chất có công thức (I) được cho tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng. Việc phòng trừ động vật gây hại tốt hơn là được thực hiện trong lĩnh vực nông nghiệp và lâm nghiệp, và trong việc bảo vệ vật liệu. Tốt hơn là việc phòng trừ này loại trừ phương pháp phẫu thuật hoặc điều trị trị liệu cho cơ thể người hoặc động vật và phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Sáng chế còn đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) làm chất diệt sinh vật gây hại, đặc biệt là chế phẩm bảo vệ cây trồng.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "chất diệt sinh vật gây hại" trong mỗi trường hợp cũng luôn bao gồm thuật ngữ "chế phẩm bảo vệ cây trồng".

Các hợp chất có công thức (I), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật nội nhiệt và tương thích tốt với môi trường, thích hợp để bảo vệ thực

vật và các cơ quan của thực vật chống lại các yếu tố bất lợi sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu sau thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, nhất là côn trùng, động vật thuộc lớp nhện, giun sán, đặc biệt là giun tròn và động vật thân mềm, các loại này thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong trồng rừng, trong các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu lưu kho, và trong khu vực vệ sinh.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, thuật ngữ "vệ sinh" cần được hiểu nghĩa là bất kỳ và tất cả các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình nhằm mục đích ngăn ngừa bệnh, đặc biệt là bệnh do nhiễm trùng, và giúp bảo vệ sức khỏe con người và động vật và/hoặc bảo vệ môi trường và/hoặc giữ sạch sẽ. Theo sáng chế, thuật ngữ này đặc biệt bao gồm các biện pháp làm sạch, khử trùng và tiệt trùng, ví dụ, vải hoặc các bề mặt cứng, đặc biệt là bề mặt làm từ thủy tinh, gỗ, xi măng, đồ sứ, đồ gốm, chất dẻo hoặc (các) kim loại, để đảm bảo rằng không có các sinh vật gây hại về mặt vệ sinh và/hoặc chất tiết của chúng. Phạm vi bảo hộ của sáng chế về mặt này tốt hơn là loại trừ các quy trình phẫu thuật hoặc điều trị trị liệu được áp dụng cho cơ thể người hoặc cơ thể động vật, và các quy trình chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc cơ thể động vật.

Thuật ngữ "khu vực vệ sinh" bao gồm tất cả các vùng, khu vực kỹ thuật và ứng dụng công nghiệp trong đó các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình vệ sinh là quan trọng, ví dụ, vệ sinh trong bếp, lò bánh, sân bay, phòng tắm, bể bơi, trung tâm thương mại, khách sạn, bệnh viện, chuồng ngựa, trại nuôi động vật, v.v..

Do đó, thuật ngữ "sinh vật gây hại về mặt vệ sinh" cần được hiểu nghĩa là một hoặc nhiều động vật gây hại mà sự có mặt của chúng trong khu vực vệ sinh là có vấn đề, đặc biệt là vì lý do sức khỏe. Do đó, mục đích chính là tránh, hoặc hạn chế ở mức tối thiểu, sự có mặt của các sinh vật gây hại về mặt vệ sinh và/hoặc sự tiếp xúc với các sinh vật này trong khu vực vệ sinh. Điều này đặc biệt có thể đạt được bằng cách sử dụng chất diệt sinh vật gây hại mà được dùng cả để ngăn ngừa sự phá hoại và để ngăn chặn sự phá hoại đã có. Cũng có thể sử dụng các chế phẩm mà ngăn ngừa hoặc làm giảm sự tiếp xúc với các sinh vật gây hại. Các sinh vật gây hại về mặt vệ sinh bao gồm, ví dụ, các sinh vật được nêu dưới đây.

Do đó, thuật ngữ "bảo vệ vệ sinh" bao gồm tất cả các hoạt động mà nhờ đó duy trì và/hoặc cải thiện các biện pháp, phương pháp dự phòng và quy trình vệ sinh.

Các hợp chất có công thức (I) tốt hơn là có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại. Các hợp chất này có hoạt tính chống lại các loài nhạy và kháng thuốc thông

thường và cũng chóng lại tất cả hoặc các giai đoạn phát triển cụ thể. Các sinh vật gây hại nêu trên bao gồm:

các sinh vật gây hại thuộc ngành Chân khớp (Arthropoda), cụ thể thuộc lớp Hình nhện (Arachnida), ví dụ, *Acarus spp.*, ví dụ, *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp.*, *Aculus spp.*, ví dụ, *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma spp.*, *Amphitetranychus viennensis*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, ví dụ, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides spp.*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor spp.*, *Eotetranychus spp.*, ví dụ, *Eotetranychus hicorniae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus spp.*, ví dụ, *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes spp.*, ví dụ, *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus spp.*, ví dụ, *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Latrodectus spp.*, *Loxosceles spp.*, *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphera spp.*, *Oligonychus spp.*, ví dụ, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros spp.*, *Ornithonyssus spp.*, *Panonychus spp.*, ví dụ, *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptuta oleivora*, *Platytranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus spp.*, *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus spp.*, ví dụ, *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus spp.*, ví dụ, *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis spp.*, *Vasates lycopersici*;

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

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

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

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

thuộc bộ Cánh cứng (Coleoptera), ví dụ, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp.*, *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus spp.*, ví dụ, *Agrilus*

planipennis, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp., ví dù, *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., ví dù, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., ví dù, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dù, *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dù, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus* spp., ví dù, *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus quadridens*, *Ceutorhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dù, *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dù, *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dù, *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp., ví dù, *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dù, *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., ví dù, *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dù, *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dù, *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dù, *Leucoptera coffeella*, *Limonius ectypus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megacyllene* spp., ví dù, *Megacyllene robiniae*, *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dù, *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dù, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dù, *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., ví dù, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dù, *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dù, *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*,

*Rhynchophorus palmarum*, *Scolytus* spp., ví dụ, *Scolytus multistriatus*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., ví dụ, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., ví dụ, *Sternechus paludatus*, *Symplyctes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ, *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ, *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ, *Zabrus tenebrioides*;

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

thuộc bộ Hai cánh (Diptera), ví dụ, *Aedes* spp., ví dụ, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ, *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ, *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondyla* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., ví dụ, *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., ví dụ, *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., ví dụ, *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., ví dụ, *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., ví dụ, *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ, *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ, *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ, *Musca domestica*, *Musca domestica* vicina, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* hoặc *Pegomyia* spp., ví dụ, *Pegomya beta*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophila casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplipsis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ, *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ, *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ, *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ Cánh nửa (Hemiptera), ví dụ, *Acizzia acaciaebailyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatooides*, *Acrida turrita*, *Acyrthosipon* spp., ví dụ, *Acyrthosiphon pisum*,

Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleurocanthus spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., ví dù, Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., ví dù, Zygina spp.; Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., ví dù, Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederae, Aphis illinoiensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraecola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., ví dù, Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., ví dù, Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Capulinia spp., Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus aonidum, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., ví dù, Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes chittendeni, Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Diuraphis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., ví dù, Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., ví dù, Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., ví dù, Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Fiorinia spp., Furcaspis oceanica, Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., ví dù, Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., ví dù, Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., ví dù, Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lopholeucaspis japonica, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., ví dù, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lilii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., ví dù, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Neomaskellia spp., Nephrotettix spp., ví dù, Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nettigonella spectra, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratriozza spp., ví dù, Paratriozza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., ví dù, Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenae, Peregrinus maidis, Perkinsiella spp., Phenacoccus spp., ví dù, Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., ví dù,

Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., ví dụ, Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., ví dụ, Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., ví dụ, Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., ví dụ, Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., ví dụ, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., ví dụ, Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sipha flava, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephela spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., ví dụ, Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., ví dụ, Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zygina spp.;

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

thuộc bộ Cánh màng (Hymenoptera), ví dụ, Acromyrmex spp., Athalia spp., ví dụ, Athalia rosae, Atta spp., Camponotus spp., Dolichovespula spp., Diprion spp., ví dụ, Diprion similis, Hoplocampa spp., ví dụ, Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema (Iridomyrmex) humile, Monomorium pharaonis, Paratrechina spp., Paravespula spp., Plagiolepis spp., Sirex spp., ví dụ, Sirex noctilio, Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Technomyrmex albipes, Urocerus spp., Vespa spp., ví dụ, Vespa crabro, Wasmannia auropunctata, Xeris spp.;

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

thuộc bộ Cánh đều (Isoptera), ví dụ, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

thuộc bộ Cánh vẩy (Lepidoptera), ví dụ, *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes spp.*, ví dụ, *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis spp.*, ví dụ, *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama spp.*, ví dụ, *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia spp.*, *Anticarsia spp.*, ví dụ, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroploce spp.*, *Autographa spp.*, *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola spp.*, *Cacoecia spp.*, *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina nipponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo spp.*, ví dụ, *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura spp.*, *Chrysodeixis chalcites*, *Clytia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp.*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia spp.*, *Conopomorpha spp.*, *Conotrachelus spp.*, *Copitarsia spp.*, *Cydia spp.*, ví dụ, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania spp.*, *Diparopsis spp.*, *Diatraea saccharalis*, *Dioryctria spp.*, ví dụ, *Dioryctria zimmermani*, *Earias spp.*, *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia spp.*, ví dụ, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia spp.*, *Epiphyas postvittana*, *Erannis spp.*, *Erschoviella musculana*, *Etiella spp.*, *Eudocima spp.*, *Eulia spp.*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis spp.*, ví dụ, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Galleria mellonella*, *Gracillaria spp.*, *Grapholitha spp.*, ví dụ, *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta spp.*, *Helicoverpa spp.*, ví dụ, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis spp.*, ví dụ, *Heliothis virescens Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma spp.*, *Homona spp.*, *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides spp.*, *Laphygma spp.*, *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera spp.*, ví dụ, *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis spp.*, ví dụ, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia spp.*, ví dụ, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp.*, ví dụ, *Lymantria dispar*, *Lyonetia spp.*, ví dụ, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis spp.*, *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula spp.*, *Oiketicus spp.*, *Omphisa spp.*, *Operophtera spp.*, *Oria spp.*, *Orthaga spp.*, *Ostrinia spp.*, ví dụ, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara spp.*, *Pectinophora spp.*, ví dụ, *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera spp.*, *Phthorimaea spp.*, ví dụ, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter spp.*, ví dụ, *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris spp.*, ví dụ, *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia spp.*, *Plutella xylostella* (=*Plutella maculipennis*), *Podesia spp.*, ví dụ, *Podesia syringae*, *Prays spp.*, *Prodenia spp.*, *Protoparce spp.*, *Pseudaletia spp.*, ví dụ, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius spp.*, ví dụ, *Schoenobius*

bipunctifer, Scirpophaga spp., ví dụ, Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., ví dụ, Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., ví dụ, Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthesdon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatalis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., ví dụ, Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;

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

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

thuộc bộ Rệp sách (Psocoptera), ví dụ, Lepinotus spp., Liposcelis spp.;

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

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

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

thuộc lớp Rết tơ (Symphyla), ví dụ, Scutigerella spp., ví dụ, Scutigerella immaculata;

các sinh vật gây hại thuộc ngành Thân mềm (Mollusca), ví dụ, thuộc lớp Hai mảnh vỏ (Bivalvia), ví dụ, Dreissena spp.;

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

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

Các hợp chất có công thức (I) có thể, trong trường hợp có thể, ở các nồng độ hoặc các tỷ lệ áp dụng nhất định, còn được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sự sinh trưởng hoặc thành phần để cải thiện các đặc tính của thực vật, làm chất khử trùng hoặc chất diệt giao tử, ví dụ, làm chất diệt nấm, chất chống nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt virut (bao gồm thành phần chống viroid) hoặc làm thành phần chống MLO (mycoplasma-like organism - sinh vật giống mycoplasma) và RLO (rickettsia-like organism - sinh vật giống rickettsia). Chúng có thể, trong trường hợp có thể, còn được sử dụng làm các hợp chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các thành phần hoạt tính khác.

### **Chế phẩm**

Sáng chế còn đề cập đến các chế phẩm và dạng sử dụng được bào chế từ các chế phẩm này làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ, các dung dịch để tưới ướt, tưới nhỏ giọt và phun, chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I). Tùy ý, các dạng sử dụng còn chứa

chất diệt sinh vật gây hại và/hoặc các chất bổ trợ mà cải thiện hoạt động, như chất xuyên thấm, ví dụ, dầu thực vật, ví dụ, dầu hạt cải, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ, dầu parafin, alkyl este của các axit béo thực vật, ví dụ, methyl este của dầu hạt cải hoặc methyl este của dầu đậu nành, hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất phân tán, ví dụ, alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ, các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ, amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng lưu giữ, ví dụ, dioctyl sulfosuccinat hoặc polyme hydroxypropylguar và/hoặc chất giữ ẩm, ví dụ, glycerol và/hoặc phân bón, ví dụ, phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

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

Ưu tiên các chế phẩm hoặc dạng sử dụng chứa chất phụ trợ, ví dụ, chất độn, dung môi, chất tăng cường khả năng tự phát, chất mang, chất nhũ hóa, chất phân tán, thành phần bảo vệ chống sương giá, chất diệt sinh vật, chất làm đặc và/hoặc các chất phụ trợ khác, ví dụ, chất bổ trợ. Chất bổ trợ trong ngũ cẩm này là thành phần mà tăng cường tác dụng sinh học của chế phẩm, nhưng bản thân thành phần này không có tác dụng sinh học bất kỳ nào. Ví dụ về các chất bổ trợ là các thành phần mà thúc đẩy sự lưu giữ, sự phân tán, sự bám dính vào bề mặt lá hoặc sự xuyên thấm.

Các chế phẩm này được sản xuất theo cách đã biết, ví dụ, bằng cách trộn các hợp chất có công thức (I) với chất phụ trợ, ví dụ, chất độn, dung môi và/hoặc chất mang rắn và/hoặc các chất phụ trợ khác, ví dụ, chất hoạt động bề mặt. Các chế phẩm này được sản xuất trong các cơ sở thích hợp hoặc ở nơi khác trước hoặc trong khi áp dụng.

Các chất phụ trợ được sử dụng có thể là các chất thích hợp để mang lại các đặc tính đặc biệt, như các đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học nhất định, cho chế phẩm chứa các hợp chất có công thức (I), hoặc cho dạng sử dụng được bào chế từ các chế phẩm này (ví dụ, chất diệt sinh vật gây hại dùng ngay như dung dịch phun hoặc sản phẩm xử lý hạt).

Các chất độn thích hợp là, ví dụ, nước, dung dịch hóa chất hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ, từ nhóm bao gồm hydrocarbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphthalen, clobenzen), rượu và rượu polyhydric (mà, nếu thích hợp,

cũng có thể được thê, được ete hóa và/hoặc được este hóa), xeton (như axeton, xyclohexanon), este (bao gồm chất béo và dầu) và (poly)ete, các amin, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton đơn giản và được thê, sulfon và sulfoxit (như dimetyl sulfoxit).

Nếu chất độn được sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, dung môi hữu cơ làm dung môi phụ trợ. Các dung môi lỏng hữu ích chủ yếu là: các dung môi thơm như xylen,toluen hoặc alkynaphtalen, dung môi thơm được clo hóa hoặc hydrocacbon béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan hoặc parafin, ví dụ, các phân đoạn dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu như butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, xeton như axeton, methyl etyl xeton, methyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimethylformamit và dimetyl sulfoxit, và cả nước.

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

Về nguyên tắc, có thể sử dụng tất cả các chất mang thích hợp. Cụ thể hơn, các chất mang thích hợp bao gồm các chất sau: ví dụ, các muối amoni và đá tự nhiên nghiền mịn như cao lanh, alumin, bột talc, đá phán, thạch anh, attapulgit, montmorilonit hoặc đất tảo silic, và đá tổng hợp nghiền mịn, như silic dioxit phân tán cao, nhôm oxit và silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, nhựa, sáp và/hoặc phân bón rắn. Cũng có thể sử dụng hỗn hợp của các chất mang này. Các chất mang hữu ích đối với hạt bao gồm: ví dụ, đá tự nhiên được phân mảnh và nghiền như canxit, đá hoa, đá bột, sepiolit, dolomit, và hạt tổng hợp từ các bột vô cơ và hữu cơ, và cả hạt từ các nguyên liệu hữu cơ như mùn cưa, giấy, vỏ dừa, lõi ngô và cuộng thuốc lá.

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

Ví dụ về các chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc thành phần thẩm urot có đặc tính ion hoặc không ion hoặc hỗn hợp của các chất hoạt động bề mặt này là các muối của axit polyacrylic, các muối của axit lignosulfonic, các muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphtalensulfonic, sản phẩm đa trùng ngưng của etylen oxit

với rượu béo hoặc với axit béo hoặc với amin béo, với các phenol được thê (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulfosucxinic, các dẫn xuất của taurin (tốt hơn là alkyl taurat), este phosphoric của rượu hoặc phenol được polyetoxyl hóa, este axit béo của rượu polyhydric, và các dẫn xuất của các hợp chất chứa sulfat, sulfonat và phosphat, ví dụ, alkylaryl polyglycol ete, alkylsulfonat, alkyl sulfat, arylsulfonat, sản phẩm thủy phân protein, dịch thải lignosulfit và methylxenluloza. Sự có mặt của chất hoạt động bề mặt là có lợi nếu một trong số các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một trong số các chất mang trợ không hòa tan được trong nước và nếu việc áp dụng diễn ra trong nước.

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

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

Ngoài ra, các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này cũng có thể chứa, dưới dạng chất phụ trợ bổ sung, chất kết dính như carboxymethylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gôm arabic, rượu polyvinylic và polyvinyl axetat, hoặc còn các phospholipit tự nhiên như xephalin và lexithin và các phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ khác có thể là dầu khoáng và dầu thực vật.

Nếu thích hợp, các chất phụ trợ khác cũng có thể có mặt trong các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này. Ví dụ về các chất phụ gia như vậy là chất tạo hương, chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất bám dính, chất làm đặc, chất xúc biến, chất xuyên thấm, chất tăng cường khả năng lưu giữ, chất làm ổn định, chất càng hóa, thành phần tạo phức, chất giữ ẩm, chất phân tán. Nói chung, các hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với chất phụ gia rắn hoặc lỏng bất kỳ thường được sử dụng cho các mục đích bào chế.

Các chất tăng cường khả năng lưu giữ hữu ích bao gồm tất cả các chất mà làm giảm sức căng bề mặt động lực, ví dụ, dioctyl sulfosucxit, hoặc làm tăng tính nhót đòn hồi, ví dụ, polyme hydroxypropylguar.

Các chất xuyên thấm hữu ích trong ngũ cành của súng chê là tất cả các chất mà thường được sử dụng để cải thiện tính xuyên thấm của các thành phần có hoạt tính hóa nông vào trong thực vật. Chất xuyên thấm được xác định trong ngũ cành này bởi khả năng xuyên thấm của chúng từ chất lỏng áp dụng (thường ở dạng nước) và/hoặc từ lớp phun phủ vào trong biểu bì của thực vật và vì vậy làm tăng khả năng di chuyển của thành phần hoạt tính trong biểu bì. Phương pháp được mô tả trong tài liệu (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) có thể được sử dụng để xác định đặc tính này. Các ví dụ bao gồm rượu alkoxylat như etoxylat béo của dừa (10) hoặc isotridexyl etoxylat (12), este của axit béo, ví dụ, methyl este của dầu hạt cải hoặc methyl este của dầu đậu nành, alkoxylat amin béo, ví dụ, etoxylat amin mỡ động vật (15), hoặc các muối amoni và/hoặc phosphoni, ví dụ, amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat.

Các chế phẩm này tốt hơn là chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 98% khói lượng, tốt hơn nữa là chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,01% đến 95% khói lượng, tốt nhất là chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 90% khói lượng, tính theo khói lượng chế phẩm.

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

## **Hỗn hợp**

Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng ở dạng hỗn hợp với một hoặc nhiều chất diệt nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt ve bét, chất diệt nhuyễn thể, chất diệt giun tròn, chất diệt côn trùng, tác nhân vi sinh vật, sinh vật có lợi, chất diệt cỏ, phân bón, chất xua đuổi chim, chất bồi dưỡng thực vật, chất tuyệt sinh, chất an toàn, hóa chất truyền tin và/hoặc chất điều hòa sự sinh trưởng của thực vật thích hợp, để bằng cách đó, ví dụ, để mở rộng phổ tác động, kéo dài thời gian tác động, tăng cường mức độ tác động, ngăn chặn sự đầy ngược hoặc ngăn chặn sự phát triển tính kháng. Ngoài ra, các tổ hợp thành phần hoạt tính thuộc loại này có thể cải thiện sự sinh trưởng của thực vật và/hoặc tính chống chịu với các yếu tố phi sinh học, ví dụ, nhiệt độ cao hoặc thấp, với hạn hán hoặc với hàm lượng nước hoặc độ mặn của đất tăng cao. Cũng có thể cải thiện đặc tính trổ hoa và kết trái, tối ưu hóa khả năng nảy mầm và sự phát triển rễ, tạo thuận lợi cho việc thu hoạch và cải thiện năng suất, tác động lên quá trình chín,

cải thiện chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm được thu hoạch, kéo dài thời gian bảo quản và/hoặc cải thiện khả năng xử lý của sản phẩm được thu hoạch.

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

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

Nếu một trong số các hợp chất được mô tả dưới đây có thể tồn tại ở các dạng hỗn biến khác nhau, thì các dạng này cũng được bao gồm ngay cả khi không được nêu một cách rõ ràng trong mỗi trường hợp. Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập, trong trường hợp có thể, cũng có thể tạo ra muối với các bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng.

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

Các thành phần hoạt tính được chỉ ra trong bản mô tả này bằng các tên thông thường của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong "The Pesticide Manual", 16th ed., British Crop Protection Council 2012, hoặc có thể được tìm thấy trên mạng Internet (ví dụ, <http://www.alanwood.net/pesticides>). Việc phân loại dựa trên hệ thống phân loại theo cơ chế tác động IRAC áp dụng tại thời điểm nộp đơn sáng chế này.

(1) Các chất ức chế acetylcholinesteraza (AChE), ví dụ, carbamat, ví dụ, alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thifanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc phosphat hữu cơ, ví dụ, acephate, azamethiphos, azinphos-etyl, azinphos-metyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-metyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metyl, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos,

pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclorfon và vamidothion.

(2) Các chất phong bế kênh clorua đóng mở cổng bởi GABA, ví dụ, xyclodien-clo hữu cơ, ví dụ, chlordan và endosulfan hoặc phenylpyrazol (fiprole), ví dụ, ethiprol và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ, pyrethroït, ví dụ, acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin S-xyclopentenyl, bioresmethrin, cycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, gama-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], deltamethrin, empenthrin [chất đồng phân (EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropothrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momfluorothrin, permethrin, phenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], prallethrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [chất đồng phân (1R)], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc methoxychlor.

(4) Các chất điều biến cạnh tranh của thụ thể axetylcholin nicotinic (nicotinic acetylcholine receptor - nAChR), ví dụ, các neonicotinoit, ví dụ, acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidaclorpid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam hoặc nicotin hoặc sulfoxaflor hoặc flupyradifuron.

(5) Các chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nAChR), ví dụ, các spinosyn, ví dụ, spinetoram và spinosad.

(6) Các chất điều biến dị lập thể của kênh clorua đóng mở cổng bởi glutamat (GluCl), ví dụ, các avermectin/milbemycin, ví dụ, abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất giả hormon sâu non, ví dụ, các chất tương tự hormon sâu non, ví dụ, hydroprene, kinoprene và methopren hoặc fenoxy carb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các chất úc chế không đặc hiệu đa dạng (nhiều vị trí), ví dụ, các alkyl halogenua, ví dụ, methyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc chloropicrin hoặc sulfuryl florua hoặc chất gây nôn borac hoặc tartar hoặc chất tạo methyl isoxyanat, ví dụ, diazomet và metam.

(9) Các chất điều biến cơ quan dây âm, ví dụ, pymetrozin hoặc flonicamide.

- (10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve, ví dụ, clofentezin, hexythiazox và diflovidazin hoặc etoxazol.
- (11) Vi sinh vật phá vỡ màng ruột của côn trùng, ví dụ, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *tenebrionis* và các protein thực vật *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- (12) Các chất ức chế ATP syntaza ty thể, như chất phá hủy ATP, ví dụ, diafenthiuron hoặc các hợp chất hữu cơ-thiếc, ví dụ, azocyclotin, cyhexatin và fenbutatin oxit hoặc propargite hoặc tetradifon.
- (13) Các chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách làm gián đoạn gradien proton, ví dụ, chlorfenapyr, DNOC và sulfluramid.
- (14) Các chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinic, ví dụ, bensultap, cartap hydrochlorua, thiocyclam, và thiosultap-natri.
- (15) Các chất ức chế sự sinh tổng hợp kitin, loại 0, ví dụ, bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.
- (16) Các chất ức chế sự sinh tổng hợp kitin, loại 1, ví dụ, buprofezin.
- (17) Các chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt là trong trường hợp bộ Hai cánh), ví dụ, cyromazin.
- (18) Các chất chủ vận thụ thể ecdyson (hormon lột xác), ví dụ, chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit và tebufenozit.
- (19) Các chất chủ vận thụ thể octopamin, ví dụ, amitraz.
- (20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp III của ty thể, ví dụ, hydrametylnon hoặc acequinocyl hoặc fluacrypyrim.
- (21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp I của ty thể, ví dụ, chất diệt ve bét METI, ví dụ, fenazaquin, fenpyroximmat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenon (Derris).
- (22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế, ví dụ, indoxacarb hoặc metaflumizone.

(23) Các chất úc ché axetyl CoA carboxylaza, ví dụ, các dẫn xuất của axit tetronic và tetramic, ví dụ, spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất úc ché vận chuyển điện tử phức hợp IV của ty thể, ví dụ, các phosphin, ví dụ, nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua, hoặc các xyanua, canxi xyanua, kali xyanua và natri xyanua.

(25) Các chất úc ché vận chuyển điện tử phức hợp II của ty thể, ví dụ, các dẫn xuất beta-keto nitril, ví dụ, cyenopyrafen và cyflumetofen và carboxanilides, ví dụ, pyflubumide.

(28) Các chất điều biến thụ thể ryanodin, ví dụ, diamit, ví dụ, chlorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit,

các thành phần hoạt tính khác, ví dụ, afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclothiaz, benzoximate, bifenazat, broflanilit, bromopropylat, chinomethionat, chloroprallethrin, cryolit, xyclaniliprol, cycloxadrid, cyhalodiamit, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoquin, fluazainadolizin, fluensulfon, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprol, fluhexafon, fluopyram, fluralaner, fluxametamide, fufenzide, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodione, kappa bifenthrin, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spirobuclofen, tetramethylfluthrin, tetraniiprol, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim và iodometan; ngoài ra, các ché phẩm dựa trên *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và các hợp chất sau: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã biết trong tài liệu WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (đã biết trong tài liệu WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1-{(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (đã biết trong tài liệu WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimethylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxy-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết trong tài liệu WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-clo-2,6-dimethylphenyl)-8-metoxy-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl etylcacbonat (đã biết trong tài liệu EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpiridin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết trong tài liệu WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết trong tài liệu JP2010/018586) (CAS Reg.No. 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden]-2,2,2-trifloaxetamit (đã biết trong tài liệu WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflopropan-2-on (đã biết trong tài liệu WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoyl)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafoetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết

trong tài liệu WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-methyl-6-(methylcarbamoyl)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã biêt trong tài liệu CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(trans-1-oxido-3-thietanyl)benzamit và 4-[(5S)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit (đã biêt trong tài liệu WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit, (+)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit và (-)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit (đã biêt trong tài liệu WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[(2E)-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1H-pyrazol-3-carbonitril (đã biêt trong tài liệu CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-clo-2-metyl-6-[(methylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (Liudaibenjiaxuanan, đã biêt trong tài liệu CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-clo-2-[(1,1-dimetyletyl)amino]carbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biêt trong tài liệu WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), 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 (đã biêt trong tài liệu WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-diclo-4-[(3,3-diclo-2-propen-1-yl)oxy]phenoxy]propoxy]-2-metoxy-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biêt trong tài liệu CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- và 2(Z)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-N-[4-(diflometoxy)phenyl]hydrazincarboxamit (đã biêt trong tài liệu CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); 3-(2,2-dicloetenyl)-2,2-dimetyl-4-(1H-benzimidazol-2-yl)phenyl este của axit xyclopropancarboxylic (đã biêt trong tài liệu CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); methyl este của axit (4aS)-7-clo-2,5-dihydro-2-[(metoxycarbonyl)[4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]carbonyl]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H)-carboxylic (đã biêt trong tài liệu CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-O-etyl-2,4-di-O-metyl-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafloetoxy)phenyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]- $\alpha$ -L-mannopyranosa (đã biêt trong tài liệu US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3.2.1]octan (đã biêt trong tài liệu WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-

1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]propanamit (đã biết trong tài liệu WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và N-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết trong tài liệu CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7).

### **Chất diệt nấm**

Các thành phần hoạt tính được chỉ ra trong bản mô tả này bằng tên thông thường của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong "Pesticide Manual" (16th Ed. British Crop Protection Council) hoặc có thể tìm kiếm được trên mạng internet (ví dụ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập trong các nhóm (1) đến (15), trong trường hợp có thể, có thể tạo ra các muối với các bazơ hoặc các axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng. Tất cả các thành phần phối trộn diệt nấm được đề cập trong các nhóm (1) đến (15), trong trường hợp có thể, có thể bao gồm các dạng hỗ biến.

- 1) Các chất ức chế sự sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ, (1.001) cyproconazole, (1.002) difenoconazole, (1.003) epoxiconazole, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamine, (1.008) fluquinconazole, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfat, (1.012) ipconazole, (1.013) metconazole, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazole, (1.018) prothiiconazole, (1.019) pyrisoxazole, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazole, (1.022) tetriconazole, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazole, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxcyclopropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxcyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-cloxcyclopropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxcyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-cloxcyclopropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxcyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxcyclopropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxcyclopropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.036) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.037) 1-((2R,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl)methyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-((2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl)methyl)-1H-

1,2,4-triazol, (1.039) 1-{{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.056) 2-{{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.057) 2-{{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.058) 2-{{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-methyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)cyclopentanol, (1.060) 5-(alylsulfanyl)-1-{{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alylsulfanyl)-1-{{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alylsulfanyl)-1-{{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]methyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(2,2,2-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimethyl-4-{{[3-(2,2,2-trifloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-

metylimidoformamit, (1.069) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(pentafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimetylphenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-[(diflometyl)sulfanyl]phenoxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.075) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-ethyl-N-metylimidoformamit, (1.081) mefentrifluconazole, (1.082) ipfentrifluconazole.

2) Các chất úc ché chuỗi hô hấp ở phúc hợp I hoặc II, ví dụ (2.001) benzovindiflupyr, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr, (2.009) isofetamid, (2.010) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (chất triệt quang dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp của chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen, (2.020) pyraziflumid, (2.021) sedaxane, (2.022) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.023) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.024) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.025) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.026) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamit, (2.027) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.028) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) 3-(diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-

inden-4-yl]-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)ethyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xcyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-methylbenzyl)-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-clo-2-ethylbenzyl)-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-methoxypropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.045) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-N-[5-methyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-methylbenzyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.048) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (2.049) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.051) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimethylbenzyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xcyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-methylbenzyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xcyclopropyl-N-(2-xcyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xcyclopropyl-N-(2-xcyclopropyl-5-methylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xcyclopropyl-N-(2-xcyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamit.

3) Các chất úc ché chuỗi hô hấp ở phúc hợp III, ví dụ, (3.001) ametoctradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017) pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019)

pyraoxystrobin, (3.020) trifloxytrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[{(1E)-1-(3-{{[(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy}phenyl)ethyliden]amino}oxy)methyl]phenyl}-2-(methoxyimino)-N-metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(methoxyimino)-N,3-dimethylpent-3-enamiy, (3.023) (2R)-2-{2-[{(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl}-2-methoxy-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[{(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl}-2-methoxy-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)methoxy]-4-methoxypyridin-2-yl)carbonyl]amino]-6-methyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-methylpropanoat, (3.026) 2-{2-[{(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl}-2-methoxy-N-metylaxetamit, (3.027) N-(3-ethyl-3,5,5-trimethylcyclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamit, (3.028) (2E,3Z)-5-{{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(methoxyimino)-N,3-dimethylpent-3-enamiit, (3.029) methyl {5-[3-(2,4-dimethylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-methylbenzyl}carbamat.

4) Các chất úc ché sự nguyên phân và sự phân chia té bào, ví dụ, (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazol, (4.007) thiophanate-metyl, (4.008) zoxamit, (4.009) 3-clo-4-(2,6-diflophenyl)-6-metyl-5-phenylpyridazin, (4.010) 3-clo-5-(4-clophenyl)-4-(2,6-diflophenyl)-6-metylpyridazin, (4.011) 3-clo-5-(6-clopyridin-3-yl)-6-metyl-4-(2,4,6-triflophenyl)pyridazin, (4.012) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.013) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.014) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.015) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.016) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.017) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.018) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.019) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.020) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.021) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.022) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimethylpyridazin, (4.023) N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.024) N-(2-bromophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.025) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-amin.

5) Các hợp chất có khả năng hoạt động nhiều vị trí, ví dụ, (5.001) hỗn hợp Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) chlorthalonil, (5.005) đồng hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxychlorua, (5.009) đồng(2+) sulfat, (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) kẽm metiram, (5.017) oxine-đồng, (5.018) propineb, (5.019) lưu huỳnh và ché phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram,

(5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etyl-5,7-dioxo-6,7-dihydro-5H-pyrolo[3',4':5,6][1,4]dithiino[2,3-c][1,2]thiazol-3-carbonitril.

6) Các hợp chất có khả năng khởi động cơ chế phòng vệ của vật chủ, ví dụ, (6.001) acibenzolar-S-metyl, (6.002) isotianil, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.

7) Các chất úc ché sự sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ, (7.001) xyprodinil, (7.002) kasugamyxin, (7.003) kasugamyxin hydroclorua hydrat, (7.004) oxytetraxyclin, (7.005) pyrimethanil, (7.006) 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

(8) Các chất úc ché sự sản sinh ATP, ví dụ, (8.001) silthiofam.

9) Các chất úc ché sự tổng hợp vách tế bào, ví dụ, (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethomorph, (9.003) flumorph, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pyrimorph, (9.007) valifenalate, (9.008) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.009) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.

10) Các chất úc ché sự tổng hợp lipit và màng, ví dụ, (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclofos-metyl.

11) Các chất úc ché sự sinh tổng hợp melanin, ví dụ, (11.001) trixyclazol, (11.002) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamat.

12) Các chất úc ché sự tổng hợp axit nucleic, ví dụ, (12.001) benalaxyl, (12.002) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.003) metalaxyl, (12.004) metalaxyl-M (mefenoxam).

13) Các chất úc ché sự truyền tín hiệu, ví dụ, (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodione, (13.003) procymidone, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.

14) Các hợp chất mà có thể tác động như chất phân tách, ví dụ, (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.

15) Các hợp chất khác, ví dụ, (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazol, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamit, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) methyl isothiocyanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomycin, (15.018) natamycin, (15.019) niken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapiprolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclophenol và muối, (15.025) axit phosphonic và muối của nó, (15.026)

propamocarb-fosetyl, (15.027) pyriofenone (chlazafenone) (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnidanide, (15.031) 1-(4-{4-[*(5R)*-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.032) 1-(4-{4-[*(5S)*-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-methyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) 2,6-dimethyl-1*H*,5*H*-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrol-1,3,5,7(2*H*,6*H*)-tetron, (15.035) 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, (15.036) 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, (15.037) 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, (15.038) 2-[6-(3-flo-4-methoxyphenyl)-5-methylpyridin-2-yl]quinazolin, (15.039) 2-{(5*R*)-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, (15.040) 2-{(5*S*)-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, (15.041) 2-{2-[(7,8-diflo-2-methylquinolin-3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-methylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.043) 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, (15.044) 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, (15.045) 2-phenylphenol và muối của nó, (15.046) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.047) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (đạng tautome: 4-amino-5-flopyrimidin-2(*1H*)-on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butyric, (15.050) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.051) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen 2-sulfonohydrazit, (15.052) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.053) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.054) 9-flo-2,2-dimetyl-5-(quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepin, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamat, (15.056) etyl (*2Z*)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, (15.057) axit phenazin-1-carboxylic, (15.058) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfat (2:1), (15.061) tert-butyl {6-[(1-metyl-1*H*-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbamat, (15.062) 5-flo-4-imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihdropyrimidin-2(*1H*)-on.

### **Chất diệt sinh vật gây hại sinh học làm thành phần phôi trộn**

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

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học đặc biệt bao gồm vi khuẩn, nấm, nấm men, chiết phẩm từ thực vật và các sản phẩm được tạo ra bởi các vi sinh vật, bao gồm protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp.

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

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

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

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

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

122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum rifai* T39 (số nộp lưu CNCM I-952).

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

virut hạt (granulosis virus - GV) *Adoxophyes orana* (sâu bướm cuốn lá trái cây mùa hè), virut hạt (GV) *Cydia pomonella* (sâu bướm đục trái), virut đa diện nhân (nuclear polyhedrosis virus - NPV) *Helicoverpa armigera* (sâu đục quả bông), mNPV *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng), mNPV *Spodoptera frugiperda* (sâu keo ăn lá), NPV *Spodoptera littoralis* (sâu lá bông châu Phi).

Cũng bao gồm vi khuẩn và nấm mà được bổ sung vào làm 'thành phần để cấy' vào thực vật hoặc các bộ phận của thực vật hoặc cơ quan thực vật và, nhờ các đặc tính cụ thể của chúng, thúc đẩy sự sinh trưởng của thực vật và sức khỏe của thực vật. Các ví dụ bao gồm:

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

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

*Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, kitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (chiết phẩm saponin của *Chenopodium quinoa*), pyrethrum/pyrethrin, *Quassia amara*, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenon, ryania/ryanodin, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, chiết phẩm Brassicaceae, đặc biệt là bột hạt cải dầu hoặc bột mù tạc.

### **Chất an toàn làm thành phần phối trộn**

Các hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với các chất an toàn, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenchlorazole (-etyl), fenclorim, flurazole, fluxofenim, furilazole, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit naphtalic, oxabetrinil, 2-metoxy-N-(4-

[(methylcarbamoyl)amino]phenyl}sulfonyl)benzamit (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

### Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả các thực vật và các bộ phận của thực vật có thể được xử lý theo sáng chế. Thực vật được hiểu trong bản mô tả này có nghĩa là tất cả các thực vật và quần thể thực vật, như các cây hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm các cây trồng có trong tự nhiên), ví dụ, cây ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiều hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), cây ngô, cây đậu tương, cây khoai tây, cây củ cải đường, cây mía, cây cà chua, cây ót chuông, cây dưa chuột, cây dưa, cây cà rốt, cây dưa hấu, cây hành, cây rau diếp, cây rau bina, cây tỏi tây, cây đậu, *Brassica oleracea* (ví dụ, cây cải bắp) và các loài rau thực vật, cây bông, cây thuốc lá, cây cải hạt dầu, và cả cây ăn quả (quả táo, lê, quả chi cam chanh và nho). Cây trồng có thể là các thực vật mà có thể thu được bằng các phương pháp nhân giống và tối ưu hóa thông thường hoặc bằng các phương pháp công nghệ sinh học và xử lý bằng kỹ thuật di truyền hoặc kết hợp các phương pháp này, bao gồm các thực vật chuyển gen và bao gồm giống cây trồng mà có thể được bảo hộ hoặc không được bảo hộ bởi quyền của người chọn tạo giống cây trồng. Các thực vật sẽ được hiểu có nghĩa là tất cả các giai đoạn phát triển như hạt, cây giống, cây con (chưa trưởng thành), lén đén và bao gồm các cây trưởng thành. Các bộ phận của thực vật sẽ được hiểu có nghĩa là tất cả các phần và các cơ quan của thực vật ở trên và dưới mặt đất, như chồi, lá, hoa và rễ, ví dụ là lá, lá kim, cuống, thân, hoa, thê quả, quả và hạt, và cả rễ, thân củ và thân rễ. Các bộ phận của thực vật cũng bao gồm các thực vật được thu hoạch hoặc các bộ phận của thực vật được thu hoạch và vật liệu nhân giống sinh dưỡng và sinh sản, ví dụ, cành giâm, thân củ, thân rễ, cành ghép và hạt.

Việc xử lý thực vật và các bộ phận của thực vật theo sáng chế bằng các hợp chất có công thức (I) được thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách để cho các hợp chất này tác động trên các vùng xung quanh, môi trường sống hoặc không gian bảo quản chúng bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ, bằng cách nhúng, phun, làm bay hơi, tạo mù, rắc, phủ lên, bơm, và, trong trường hợp vật liệu nhân giống, cụ thể là trong trường hợp hạt giống, cả bằng cách áp dụng một hoặc nhiều lớp phủ.

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

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

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

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen (các loài thu được bằng kỹ thuật di truyền) ưu tiên cần được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các thực vật mà, thông qua sự biến đổi di truyền, nhận được vật liệu di truyền mà sẽ truyền các đặc tính (“tính trạng”) hữu ích đặc biệt có lợi cho các thực vật này. Ví dụ về các đặc tính này là sự sinh trưởng tốt hơn, khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp tăng, khả năng chịu hạn hoặc các mức nước hoặc độ mặn của đất tốt hơn, hiệu suất ra hoa tăng, thu hoạch dễ hơn, nhanh chín hơn, năng suất thu hoạch cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng cao hơn của các sản phẩm được thu hoạch, khả năng bảo quản và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn. Các ví dụ khác và được đặc biệt nhấn mạnh về các đặc tính như vậy là tăng tính chống chịu của thực vật đối với các động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại côn trùng, nhện, giun tròn, ve bét, ốc sên và ốc, ví dụ nhờ các độc tố được tạo ra trong thực vật, đặc biệt là các độc tố được tạo ra trong thực vật bằng vật liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, bởi các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả tổ hợp của các gen này), và cả tăng tính chống chịu của thực vật đối với nấm, vi khuẩn và/hoặc virut gây bệnh thực vật, ví dụ, gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (systemic acquired resistance - SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc tố được biểu hiện tương ứng, và còn tăng khả năng chịu của thực vật đối với một số thành phần có hoạt tính diệt cỏ nhất định, ví dụ, các imidazolinon, sulphonylure, glyphosat hoặc phosphinothricin (ví dụ, gen "PAT"). Các gen truyền đặc tính (“tính trạng”) mong muốn cũng có thể có mặt kết hợp với nhau trong thực vật chuyển gen. Ví dụ về thực vật chuyển gen đã nêu bao gồm các cây trồng quan trọng, như ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía, cà chua, đậu Hà lan và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải hạt dầu và cả thực vật lấy quả (các loại quả là táo, lê, các loại quả chi cam chanh và nho), đặc biệt nhấn mạnh có thể kể đến ngô, đậu tương, lúa mì, lúa, khoai tây, bông, mía, thuốc lá và cải hạt dầu. Các đặc tính (“tính trạng”) đặc biệt được nhấn mạnh là tăng tính chống chịu của thực vật đối với côn trùng, nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

### **Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý**

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

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

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

### Xử lý hạt

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

sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật này màm với lượng chất diệt sinh vật gây hại tối thiểu.

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

Sáng chế cũng đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong xử lý hạt để bảo vệ hạt và thực vật này màm khỏi động vật gây hại.

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

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

Một trong số các ưu điểm có được khi hợp chất có công thức (I) tác động theo đường nội hấp là ở chỗ việc xử lý hạt không chỉ bảo vệ bản thân hạt, mà còn bảo vệ cả thực vật thu được từ đó, sau khi mọc, khỏi động vật gây hại. Theo phương thức này, có thể không cần xử lý ngay cho cây trồng ở thời điểm gieo hạt hoặc ngay sau đó.

Một ưu điểm nữa là việc xử lý hạt bằng hợp chất có công thức (I) có thể làm tăng khả năng nảy mầm và mọc của hạt đã xử lý.

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

Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng kết hợp với các chế phẩm trong lĩnh vực công nghệ truyền tín hiệu, dẫn đến khả năng khu trú tốt hơn của các sinh vật cộng sinh, ví dụ, chủng vi khuẩn nốt rẽ, nấm cộng sinh mycorrhizae và/hoặc vi khuẩn hoặc nấm nội ký sinh thực vật, và/hoặc dẫn đến khả năng cố định nitơ tối ưu.

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

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

Trong ngữ cảnh của sáng chế, hợp chất có công thức (I) được áp dụng lên hạt. Tốt hơn là, hạt được xử lý ở trạng thái trong đó hạt này đủ ổn định để không xảy ra thương tổn bất kỳ trong quá trình xử lý. Nói chung, hạt có thể được xử lý vào thời điểm bất kỳ từ khi thu hoạch đến khi gieo. Thường sử dụng hạt đã được tách ra khỏi cây và tách khỏi lõi, vỏ hạt, cuống, vỏ, lông hoặc thịt quả. Ví dụ, có thể sử dụng hạt mà hạt này đã được thu hoạch, làm sạch và làm khô đến hàm lượng ẩm cho phép để bảo quản. Theo cách khác, cũng có thể sử dụng hạt mà sau khi làm khô đã được xử lý bằng, ví dụ, nước và sau đó làm khô lại, ví dụ, mồi nước. Trong trường hợp hạt lúa, cũng có thể sử dụng hạt mà đã được ngâm, ví dụ, trong nước đến khi đạt đến giai đoạn mầm lúa nhất định (“giai đoạn úc bồ câu”) mà kích thích khả năng nảy mầm và khả năng mọc đồng đều hơn.

Khi xử lý hạt, cần phải cẩn thận ở chỗ, lượng hợp chất có công thức (I) được đưa lên hạt và/hoặc lượng các chất phụ gia khác được chọn theo cách sao cho sự nảy mầm của hạt không bị ảnh hưởng bất lợi, hoặc sao cho cây thu được không bị thương tổn. Điều này cần phải được bảo đảm, nhất là trong trường hợp các thành phần hoạt tính mà có thể biểu hiện các tác dụng gây độc cho thực vật với tỷ lệ áp dụng nhất định.

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

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

Các chế phẩm này được điều chế theo cách đã biết, bằng cách trộn các hợp chất có công thức (I) với chất phụ gia thông thường, ví dụ, chất độn và dung môi thông thường hoặc chất pha loãng, chất màu, thành phần thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất bám dính, giberelin và cả nước.

Chất màu mà có thể có trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất màu mà thường dùng cho mục đích này. Có thể sử dụng phẩm màu ít tan trong nước hoặc chất màu tan trong nước. Ví dụ bao gồm các chất màu đã biết với tên Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 và C.I. Solvent Red 1.

Thành phần thấm ướt hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất mà tăng cường sự thấm ướt và thường dùng trong việc phối chế các thành phần có hoạt tính hóa nông. Tốt hơn nếu sử dụng alkyl naphthalensulfonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphthalensulfonat.

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

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

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

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

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

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

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

Để xử lý hạt bằng chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế, hoặc các dạng sử dụng được bào chế từ chế phẩm này bằng cách bổ sung thêm nước, tất cả các đơn vị phối trộn thường dùng để xử lý hạt đều hữu ích. Cụ thể, quy trình trong xử lý hạt là đưa hạt vào trong thiết bị trộn vận hành theo từng mé hoặc vận hành liên tục, bổ sung lượng chế phẩm xử lý hạt mong muốn cụ thể, ở dạng nguyên chất hoặc sau khi pha loãng trước bằng nước và trộn cho tới khi chế phẩm này được phân bố đồng đều lên hạt. Tiếp theo là thao tác làm khô, nếu thích hợp.

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

### Sức khỏe của động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, tức lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) có hoạt tính chống lại các sinh vật ký sinh trên động vật, đặc biệt là sinh vật ngoại ký

sinh hoặc sinh vật nội ký sinh. Thuật ngữ "sinh vật nội ký sinh" bao gồm đặc biệt là giun sán và động vật nguyên sinh, như cầu trùng coccidia. Sinh vật ngoại ký sinh điển hình và tốt hơn là động vật chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc ve bét.

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

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

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

Theo một phương án cụ thể, các hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho động vật có vú.

Theo một phương án cụ thể khác, các hợp chất có công thức (I) được sử dụng cho chim, tức là chim cảnh hoặc đặc biệt là gia cầm.

Việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) để phòng trừ động vật ký sinh dự định để làm giảm hoặc phòng ngừa sự ốm yếu, các trường hợp chết và sự suy giảm năng suất (trong trường hợp thịt, sữa, len, da sống, trứng, mật và sản phẩm tương tự), sao cho việc bảo vệ động vật kinh tế hơn và đơn giản hơn và động vật có thể có được sức khỏe tốt hơn.

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

Động vật chân khớp bao gồm, ví dụ, nhưng không chỉ giới hạn ở,

thuộc bộ Anoplurida, ví dụ, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. và *Solenopotes* spp.;

thuộc bộ Mallophagida và phân bộ Amblycerina và Ischnocerina, ví dụ, *Bovicola* spp., *Damalina* spp., *Felicola* spp.; *Lepikentron* spp., *Menopon* spp., *Trichodectes* spp., *Trimenopon* spp., *Trinoton* spp., *Werneckiella* spp; *Werneckiella* spp;

thuộc bộ Diptera và phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Atylotus* spp., *Braula* spp., *Calliphora* spp., *Chrysomyia* spp., *Chrysops* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Eusimulium* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematobia* spp., *Haematopota* spp., *Hippobosca* spp., *Hybomitra* spp., *Hydrotaea* spp., *Hypoderma* spp., *Lipoptena* spp., *Lucilia* spp., *Lutzomyia* spp., *Melophagus* spp., *Morellia* spp., *Musca* spp., *Odagmia* spp., *Oestrus* spp., *Philipomyia* spp., *Phlebotomus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tipula* spp., *Wilhelmia* spp., *Wohlfahrtia* spp.;

thuộc bộ Siphonapterida, ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.;

thuộc bộ cánh nửa (heteropterida), ví dụ, *Cimex* spp., *Panstrongylus* spp., *Rhodnius* spp., *Triatoma* spp.; và cả các sinh vật gây phiền toái và gây hại về mặt vệ sinh thuộc bộ Blattarida.

Ngoài ra, trong trường hợp động vật chân khớp, cần kể đến làm ví dụ, mà không chỉ giới hạn ở các ve bét sau:

thuộc phân lớp ve bét (Acarina) và bộ Metastigmata, ví dụ, từ họ Argasidae như *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., từ họ Ixodidae như *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (chi gốc của ve bét nhiều vật chủ); thuộc bộ Mesostigmata như *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; thuộc bộ Actinedida (Prostigmata), ví dụ, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; và thuộc bộ Acaridida (Astigmata), ví dụ, *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp., *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

Ví dụ về động vật nguyên sinh ký sinh bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở:

Mastigophora (Flagellata), như:

Metamonada: thuộc bộ Diplomonadida, ví dụ, Giardia spp., Spironucleus spp.

Parabasala: thuộc bộ Trichomonadida, ví dụ, Histomonas spp., Pentatrichomonas spp., Tetra-trichomonas spp., Trichomonas spp., Tritrichomonas spp.

Euglenozoa: thuộc bộ Trypanosomatida, ví dụ, Leishmania spp., Trypanosoma spp.

Sarcomastigophora (Rhizopoda) như Entamoebidae, ví dụ, Entamoeba spp., Centramoebidae, ví dụ, Acanthamoeba sp., Euamoebidae, ví dụ, Hartmanella sp.

Alveolata như Apicomplexa (Sporozoa): ví dụ, Cryptosporidium spp.; thuộc bộ Eimeriida, ví dụ, Besnoitia spp., Cystoisospora spp., Eimeria spp., Hammondia spp., Isospora spp., Neospora spp., Sarcocystis spp., Toxoplasma spp.; thuộc bộ Adeleida, ví dụ, Hepatozoon spp., Klossiella spp.; thuộc bộ Haemosporida, ví dụ, Leucocytozoon spp., Plasmodium spp.; thuộc bộ Piroplasmida, ví dụ, Babesia spp., Ciliophora spp., Echinocystis spp., Theileria spp.; thuộc bộ Vesibuliferida, ví dụ, Balantidium spp., Buxtonella spp.

Microspora như Encephalitozoon spp., Enterocytozoon spp., Globidium spp., Nosema spp., và cả, ví dụ, Myxozoa spp.

Giun sán gây bệnh cho người hoặc động vật bao gồm, ví dụ, Acanthocephala, giun tròn, Pentastoma và Platyhelminthes (ví dụ, Monogenea, sán dây và sán lá).

Giun sán dùng để minh họa bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở:

Monogenea: ví dụ, Dactylogyrus spp., Gyrodactylus spp., Microbothrium spp., Polystoma spp., Troglecephalus spp.;

Sán dây: thuộc bộ Pseudophyllidea, ví dụ: Bothridium spp., Diphyllobothrium spp., Diplogonoporus spp., Ichthyobothrium spp., Ligula spp., Schistocephalus spp., Spirometra spp.

Thuộc bộ vien diệp (Cyclophyllida), ví dụ: Andyra spp., Anoplocephala spp., Avitellina spp., Bertiella spp., Cittotaenia spp., Davainea spp., Diorchis spp., Diplopolydium spp., Dipylidium spp., Echinococcus spp., Echinocotyle spp., Echinolepis spp., Hydatigera spp., Hymenolepis spp., Joyeuxiella spp., Mesocestoides spp., Moniezia spp., Paranoplocephala spp., Raillietina spp., Stilesia spp., Taenia spp., Thysaniezia spp., Thysanosoma spp.

Sán lá: thuộc lớp Digenea, ví dụ: *Austrobilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catatropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyriclum* spp., *Cotylophoron* spp., *Cyclocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinochasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Troglotrema* spp., *Typhlocoelum* spp.

Giun tròn: thuộc bộ Trichinellida, ví dụ: *Capillaria* spp., *Trichinella* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichuris* spp.

Thuộc bộ Tylenchida, ví dụ: *Micronema* spp., *Parastrangyloides* spp., *Strongyloides* spp.

Thuộc bộ Rhabditina, ví dụ: *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Bronchonema* spp., *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Cooperia* spp., *Cooperioides* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cyclodontostomum* spp., *Cylicocyclus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Cystocaulus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Globocephalus* spp., *Graphidium* spp., *Gyalocephalus* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Hyostrongylus* spp., *Marshallagia* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Neostrongylus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Oesophagodontus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp.; *Ornithostrongylus* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Paracooperia* spp., *Paracrenosoma* spp., *Parafilaroides* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Pneumocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Poteriostomum* spp., *Protostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Stephanurus* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Teladorsagia* spp., *Trichonema* spp., *Trichostrongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Troglotrostrongylus* spp., *Uncinia* spp.

Thuộc bộ Spirurida, ví dụ: *Acanthocheilonema* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp.; *Ascaris* spp., *Ascarops* spp., *Aspicularis* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Cercopithifilaria* spp., *Crassicauda* spp., *Dipetalonema* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp.; *Draschia* spp., *Enterobius* spp., *Filaria* spp., *Gnathostoma* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Heterakis* spp.; *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Onchocerca* spp., *Oxyuris* spp., *Parabronema* spp., *Parafilaria* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Physaloptera* spp., *Probstmayria* spp., *Pseudofilaria* spp., *Setaria* spp.,

*Skjabinema* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Strongyluris* spp., *Syphacia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Wuchereria* spp.

Lớp Giun dây gai (*Acanthocephala*): thuộc bộ *Oligacanthorhynchida*, ví dụ: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; thuộc bộ *Moniliformida*, ví dụ: *Moniliformis* spp.

Thuộc bộ *Polymorphida*, ví dụ: *Filicollis* spp.; thuộc bộ *Echinorhynchida*, ví dụ, *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.

*Pentastoma*: thuộc bộ *Porocephalida*, ví dụ, *Linguatula* spp.

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

Do đó, theo một phương án, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) để dùng làm thuốc.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) để dùng làm chất chống sinh vật nội ký sinh.

Theo khía cạnh cụ thể khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) để dùng làm chất chống giun sán, đặc biệt là làm chất diệt giun tròn, chất diệt giun dẹp, chất diệt động vật đầu móc hoặc chất diệt động vật nấm giác.

Theo khía cạnh cụ thể khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất công thức (I) để sử dụng làm chất chống động vật nguyên sinh.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) để dùng làm chất chống sinh vật ngoại ký sinh, đặc biệt là làm chất diệt động vật chân khớp, rất đặc biệt là chất diệt côn trùng hoặc chất diệt ve bét.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến chế phẩm thú y chứa lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất có công thức (I) và ít nhất một thành phần sau: tá dược dược dụng (ví dụ, chất pha loãng rắn hoặc lỏng), chất phụ trợ dược dụng (ví dụ, chất hoạt động bề mặt), đặc biệt là tá dược dược dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ dược dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y.

Theo khía cạnh có liên quan, sáng chế đề cập đến phương pháp sản xuất chế phẩm thú y như được mô tả ở đây, phương pháp này bao gồm bước trộn ít nhất một hợp chất có công thức (I) với tá dược và/hoặc chất phụ trợ dược dụng, đặc biệt là tá dược dược

dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ thường dùng trong các chế phẩm thú y.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các chế phẩm thú y được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt sinh vật ngoại ký sinh và diệt sinh vật nội ký sinh, đặc biệt được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun sán, diệt động vật nguyên sinh và diệt động vật chân khớp, rất đặc biệt là được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun tròn, diệt giun dẹt, diệt động vật đầu móc, diệt động vật năm giác, diệt côn trùng và trừ nhện, theo các khía cạnh đã nêu, và phương pháp sản xuất các chế phẩm này.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, bằng cách sử dụng lượng hữu hiệu hợp chất có công thức (I) cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người, cần được điều trị.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, bằng cách sử dụng các chế phẩm thú y được xác định trong bản mô tả cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người, có nhu cầu sử dụng.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người.

Trong ngữ cảnh về sức khỏe động vật hoặc thuốc thú y này, thuật ngữ "điều trị" bao gồm việc điều trị dự phòng, dự phòng bùng phát và trị liệu.

Theo một phương án cụ thể, theo cách này, sáng chế đề xuất hỗn hợp gồm ít nhất một hợp chất có công thức (I) với các thành phần hoạt tính khác, đặc biệt là với chất diệt sinh vật nội và ngoại ký sinh, dùng cho lĩnh vực thuốc thú y.

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, "hỗn hợp" không chỉ có nghĩa là hai (hoặc nhiều) thành phần hoạt tính khác nhau được phối chế trong chế phẩm chung và theo đó sử dụng cùng nhau, mà còn liên quan đến các sản phẩm chứa chế phẩm riêng rẽ của từng thành phần hoạt tính. Theo đó, khi nhiều hơn hai thành phần hoạt tính được sử dụng, tất cả các thành phần hoạt tính có thể được phối chế trong cùng một chế phẩm chung hoặc tất cả các thành phần hoạt tính có thể được phối chế trong các chế phẩm riêng rẽ; tương tự có thể ở dạng trộn lẫn trong đó một số thành phần hoạt tính được phối chế cùng nhau và một số thành phần hoạt tính được phối chế riêng rẽ. Các chế phẩm riêng rẽ cho phép áp dụng riêng rẽ hoặc lần lượt các thành phần hoạt tính cần quan tâm.

Các thành phần hoạt tính được xác định ở đây bằng "tên thông thường" của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu "Pesticide Manual" (xem trên đây) hoặc có thể được tra cứu trên mạng Internet (ví dụ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Các thành phần hoạt tính làm ví dụ từ nhóm gồm các chất diệt sinh vật ngoại ký sinh như các thành phần phôi trộn bao gồm, mà không dự định chỉ giới hạn ở, chất diệt côn trùng và chất diệt ve bét được liệt kê chi tiết trên đây. Các thành phần hoạt tính dùng được khác được liệt kê sau đây theo cách phân loại đã nêu dựa trên hệ thống phân loại dựa trên phương thức tác động IRAC: (1) Chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE); (2) chất phong bế kênh clorua đóng mở cổng bởi GABA; (3) chất điều biến kênh natri; (4) chất điều biến cạnh tranh của thụ thể axetylcholine nicotin (nAChR); (5) chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR); (6) chất điều biến dị lập thể kênh clorua đóng mở cổng bởi glutamat (GluCl); (7) chất giả hormon sâu non; (8) chất ức chế không đặc hiệu hỗn hợp (nhiều vị trí); (9) chất điều biến cơ quan dây âm; (10) chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét; (12) chất ức chế ATP synthaza ti thể, như chất phá vỡ ATP; (13) chất phân tách sự phosphoryl hóa oxy hóa thông qua việc phá vỡ gradien proton; (14) chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotin; (15) chất ức chế sự sinh tổng hợp kitin, loại 0; (16) chất ức chế sự sinh tổng hợp kitin, loại 1; (17) chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt trong trường hợp bộ hai cánh); (18) chất chủ vận thụ thể ecdyson (hormon lột xác); (19) chất chủ vận thụ thể octopamin; (21) chất ức chế vận chuyển điện tử phíc I của ty thể; (25) chất ức chế vận chuyển điện tử phíc II của ty thể; (20) chất ức chế vận chuyển điện tử phíc III của ty thể; (22) chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế; (23) chất ức chế axetyl CoA carboxylaza; (28) chất điều biến thụ thể ryanodin;

các thành phần hoạt tính có cơ chế tác động chưa biết hoặc không đặc hiệu, ví dụ, fentrifanil, fenoxacrim, xyclopren, clobenzilat, chlordimeform, flubenzimin, dicyclanil, amidoflumet, quinomethionat, triarathen, clothiazaben, tetrasul, kali oleat, dầu mỏ, metoxadiazon, gossyplur, flutenzin, brompropylat, cryolit;

các hợp chất thuộc nhóm khác, ví dụ, butacarb, dimetilan, cloethocarb, phosphocarb, pirimiphos(-etyl), parathion(-etyl), methacrifos, isopropyl o-salixylat, trichlorfon, sulprofos, propaphos, sebufos, pyridathion, prothoate, dichlofenthion, demeton-S-metyl sulfon, isazofos, xyanofenphos, dialifos, carbophenothon, autathiofos, aromfenvinfos(-metyl), azinphos(-etyl), chlorpyrifos(-etyl), fosmethilan, iodofenphos, dioxabenzofos, formothion, fonofos, flupyrazofos, fensulfothion, etrimfos;

các hợp chất clo hữu cơ, ví dụ, camphechlor, lindan, heptachlor; hoặc phenylpyrazol, ví dụ, axetoprol, pyrafluprol, pyriprol, vaniliprol, sisapronil; hoặc isoxazoline, ví dụ, sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;

các pyrethroid, ví dụ, (cis-, trans-)metofluthrin, profluthrin, flufenprox, flubrocythrinat, fubfenprox, fenfluthrin, protrifenbut, pyresmethrin, RU15525, terallethrin, cis-resmethrin, heptafluthrin, bioetanomethrin, biopermethrin, fenpyrithrin, cis-cypermethrin, cis-permethrin, clopythrin, cyhalothrin (lamda-), chlovaporthrin, hoặc các hợp chất hydrocacbon được halogen hóa (HCH),

các neonicotinoit, ví dụ, nithiazin

dicloromezotiaz, triflumezopyrim

các lacton vòng lớn, ví dụ, nemadectin, ivermectin, latidectin, moxidectin, selamectin, eprinomectin, doramectin, emamectin benzoat; milbemycin oxim

triprene, epofenonane, diofenolan;

các hợp chất sinh học, hormon hoặc pheromon, ví dụ, các sản phẩm tự nhiên, ví dụ, thuringiensin, codlemon hoặc các thành phần của cây sầu đâu

các dinitrophenol, ví dụ, dinocap, dinobuton, binapacryl;

các benzoylure, ví dụ, fluazuron, penfluron,

các dẫn xuất amidin, ví dụ, chlormebuform, cymiazole, demiditraz

chất diệt ve bét varroa ở tò ong, ví dụ, các axit hữu cơ, ví dụ, axit formic, axit oxalic.

Các thành phần hoạt tính minh họa từ nhóm gồm chất diệt sinh vật nội ký sinh, làm thành phần phối trộn, bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở các, thành phần hoạt tính diệt giun sán và các thành phần hoạt tính diệt động vật nguyên sinh.

Các thành phần hoạt tính diệt giun sán bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các thành phần hoạt tính diệt giun tròn, diệt sán lá và/hoặc diệt sán dây sau:

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

thuộc nhóm benzimidazol và probenzimidazol, ví dụ: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, thiophanat, parbendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, thiabendazol, xyclobendazole, cambendazol, albendazol sulfoxit, albendazol, flubendazol;

thuộc nhóm depsipeptit, tốt hơn là các depsipeptit vòng, đặc biệt là các depsipeptit vòng 24 cạnh, ví dụ: emodepsit, PF1022A;

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

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

thuộc nhóm aminophenylamidin, ví dụ: amidantel, amidantel được loại axyl (deacylated amidantel - dAMD), tribendimidin;

thuộc nhóm aminoaxetonitril, ví dụ: monepantel;

thuộc nhóm paraherquamit, ví dụ: paraherquamit, derquantel;

thuộc nhóm salixylanilit, ví dụ: tribromsalan, bromoxanit, brotianit, clioxanit, closantel, niclosamit, oxyclozanit, rafoxanit;

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

thuộc nhóm các hợp chất phosphat hữu cơ, ví dụ: trichlorfon, naphthalofos, dichlorvos/DDVP, crufomat, coumaphos, haloxon;

thuộc nhóm piperazinon/quinolin, ví dụ: praziquantel, epsiprantel;

thuộc nhóm piperazin, ví dụ: piperazin, hydroxyzin;

thuộc nhóm tetracyclin, ví dụ: tetracyclin, clotetracyclin, doxycyclin, oxytetracyclin, rolitetracyclin;

thuộc các nhóm khác, ví dụ: bunamidin, niridazol, resorantel, omphalotin, oltipraz, nitroscanat, nitroxynil, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanthon, hycanthon, hetolin, emetin, dietylcarbamazin, diclophen, diamfenetide, clonazepam, bephenium, amoscanat, clorsulon.

Các thành phần hoạt tính diệt động vật nguyên sinh bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các thành phần hoạt tính sau:

thuộc nhóm triazin, ví dụ: diclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;

thuộc nhóm thể mang ion polyete, ví dụ: monensin, salinomycin, maduramicin, narasin;

thuộc nhóm lacton vòng lớn, ví dụ: milbemycin, erythromycin;

thuộc nhóm quinolon, ví dụ: enrofloxacin, pradofloxacin;

thuộc nhóm quinin, ví dụ: cloquin;

thuộc nhóm pyrimidin, ví dụ: pyrimethamin;

thuộc nhóm sulfonamit, ví dụ: sulfaquinoxalin, trimetoprim, sulfaclozin;

thuộc nhóm thiamin, ví dụ: amprolium;

thuộc nhóm lincosamit, ví dụ: clindamycin;

thuộc nhóm carbanilit, ví dụ: imidocarb;

thuộc nhóm nitrofuran, ví dụ: nifurtimox;

thuộc nhóm quinazolinon alkaloit, ví dụ: halofuginon;

thuộc các nhóm khác, ví dụ: oxamniquin, paromomycin;

thuộc nhóm vacxin hoặc kháng nguyên từ vi sinh vật, ví dụ: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis canis, Dictyocaulus viviparus.

Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập, trong trường hợp có thể, cũng có thể tạo ra muối với các bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng.

### **Phòng trừ vật truyền**

Các hợp chất có công thức (I) cũng có thể được sử dụng trong việc phòng trừ vật truyền. Trong ngữ cảnh của sáng chế, vật truyền là động vật chân khớp, đặc biệt là côn trùng hoặc nhện, có khả năng truyền mầm bệnh, ví dụ, virut, giun, sinh vật đơn bào và vi khuẩn, từ ổ chứa (thực vật, động vật, người, v.v.) sang vật chủ. Mầm bệnh có thể được truyền theo kiểu cơ học (ví dụ, đau mắt hột do ruồi không đốt) sang vật chủ hoặc sau khi chích đốt vào vật chủ (ví dụ, ký sinh trùng sốt rét do muỗi).

Ví dụ về các vật truyền và bệnh hoặc mầm bệnh mà chúng truyền là:

#### 1) Muỗi

- Anopheles: bệnh sốt rét, bệnh giun chỉ;

- Culex: bệnh viêm não Nhật Bản, bệnh giun chỉ, các bệnh khác do virut gây ra, truyền các loại giun khác;
- Aedes: bệnh sốt vàng, sốt Dengue, các bệnh khác do virut, gây ra, bệnh giun chỉ;
- Simuliidae: truyền giun, đặc biệt là Onchocerca volvulus;
- Psychodidae: truyền bệnh Leishmania

2) Cháy rận: nhiễm trùng da, dịch sốt phát ban;

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

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

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

6) Tích: bệnh do xoắn khuẩn borellia như Borrelia bungdorferi sensu lato., Borrelia duttoni, viêm não do tích đốt, sốt Q (Coxiella burnetii), bệnh babesia (Babesia canis canis), bệnh do Ehrlichia gây giảm bạch cầu.

Ví dụ về các vật truyền trong ngũ cẩm của súng ché là côn trùng, ví dụ, rệp, ruồi, rày hoặc bọ trĩ, các vật truyền này có thể truyền virut thực vật sang thực vật. Các vật truyền khác có khả năng truyền virut thực vật là nhện đỏ, cháy rận, bọ cánh cứng và giun tròn.

Ví dụ khác về các vật truyền trong ngũ cẩm của súng ché là côn trùng và nhện như muỗi, đặc biệt là chi Aedes, Anopheles, ví dụ, A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (sốt rét) và Culex, Psychodidae như Phlebotomus, Lutzomyia, cháy rận, bọ chét, ruồi, mạt và tích, các vật truyền này có khả năng truyền mầm bệnh sang động vật và/hoặc người.

Việc phòng trừ vật truyền cũng có thể thực hiện nếu như hợp chất có công thức (I) phá vỡ tính kháng.

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng trong việc phòng ngừa bệnh và/hoặc mầm bệnh được truyền bởi vật truyền. Do đó, theo một khía cạnh khác, súng ché để cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) để phòng trừ vật truyền, ví dụ, trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong lâm nghiệp, trong các khu vườn và trong các cơ sở giải trí và cả trong bảo vệ vật liệu và các sản phẩm lưu kho.

## Bảo vệ các vật liệu công nghiệp

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

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

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

Theo một phương án khác, các hợp chất có công thức (I) có dạng chất diệt sinh vật gây hại sẵn sàng để dùng ngay, có nghĩa là chúng có thể được áp dụng lên vật liệu mong muốn mà không cần biến đổi thêm. Chất diệt côn trùng khác hoặc chất diệt nấm hữu ích đặc biệt bao gồm các chất nêu trên.

Cũng đã bắt ngờ phát hiện rằng các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để bảo vệ các đối tượng tiếp xúc với nước mặn hoặc nước lợ, đặc biệt là thân tàu thủy, sàn, lưới, tòa nhà, nơi neo giữ tàu và các hệ thống truyền tín hiệu, chống lại sự đóng cặn. Tương tự, cũng có thể sử dụng các hợp chất có công thức (I), riêng rẽ hoặc trong hỗn hợp cùng với các thành phần hoạt tính khác, làm thành phần chống cáu gi.

## Phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh

Các hợp chất có công thức (I) thích hợp để phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh. Cụ thể hơn, sáng chế có thể được sử dụng trong lĩnh vực bảo vệ trong gia đình, trong lĩnh vực bảo vệ vệ sinh và để bảo vệ các sản phẩm lưu kho, đặc biệt là để phòng trừ côn trùng, nhện, titch và ve bét bắt gặp trong các không gian kín như khu vực nhà ở, các sảnh nhà máy, văn phòng, cabin của phương tiện giao thông, các cơ sở nhân giống động vật. Để phòng trừ động vật gây hại, các hợp chất có công thức (I) được sử dụng riêng rẽ hoặc kết hợp với các thành phần hoạt tính khác và/hoặc các chất phụ trợ. Các hợp chất theo sáng chế tốt hơn được sử dụng trong các sản phẩm diệt côn trùng trong gia đình. Các hợp chất có công thức (I) có hiệu quả chống lại các loài nhạy và kháng và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển.

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

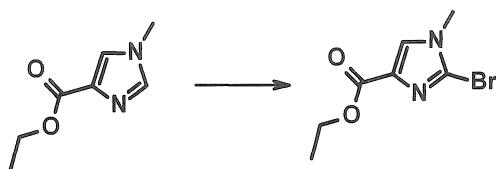
Saltatoria hoặc Orthoptera, Siphonaptera và Zygentoma và thuộc lớp Malacostraca bộ Isopoda.

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

### Ví dụ thực hiện sáng chế

#### Các ví dụ điều chế

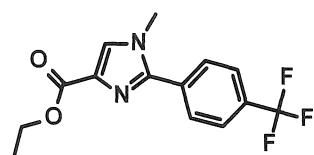
##### Etyl 2-bromo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat



30 g (193,5 mmol) etyl 1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat được hòa tan trong 500 ml tetrahydrofuran và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C. 34,5 g (193,5 mmol) NBS được bỏ sung mỗi lần một ít vào dung dịch này, và hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Phản ứng này được làm kết thúc bằng cách bỏ sung dung dịch natri thiosulfat ( $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ ) bão hòa và 800 ml etyl axetat được bỏ sung vào. Các pha được tách ra và pha nước được chiết ba lần, mỗi lần bằng 800 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulphat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien ete dầu mỏ / etyl axetat làm pha động.

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz,  $\text{D}_6\text{-DMSO}$ )  $\delta$  ppm: 1,26 (t, 3H), 3,64 (s, 3H), 4,22 (q, 2H), 8,07 (s, 1H).

##### Etyl 1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat

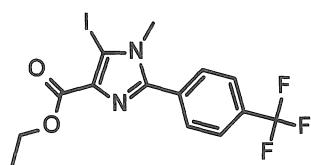


Bổ sung 3,2 g (4,4 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi, 9,1 g (85,8 mmol) natri

cacbonat và 16,4 g (86,3 mmol) axit (4-triflometyl)phenylboronic vào dung dịch chứa 10 g (43,1 mmol) etyl 2-bromo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat trong 1,2-dimetoxyetan (30 ml) và nước (10 ml) trong môi trường khí nitơ. Hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ 80°C qua đêm. Sau đó, hỗn hợp này được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng và được chiết hai lần, mỗi lần bằng 100 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien ete dầu mỏ / etyl axetat làm pha động.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,28 (t, 3H), 3,85 (s, 3H), 4,25 (q, 2H), 7,86-7,89 (m, 2H), 7,97-8,00 (m, 2H), 8,09 (s, 1H).

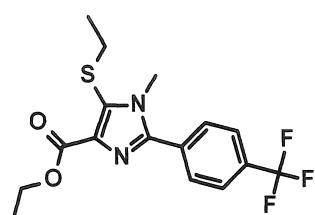
#### Etyl 5-iodo-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat



Bổ sung 7,9 g (35,1 mmol) N-iodosucxinimitz (NIS) vào dung dịch chứa 5,2 g (17,4 mmol) etyl 1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat trong axit axetic (20 ml). Hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Sau đó, hỗn hợp này được cô dưới áp suất thấp và được pha loãng bằng cách bổ sung dung dịch natri thiosulfat bão hòa. Độ pH được điều chỉnh đến độ pH = 7-8 bằng cách bổ sung dung dịch natri cacbonat bão hòa. Sau đó, hỗn hợp này được chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien ete dầu mỏ / etyl axetat làm pha động.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,31 (t, 3H), 3,74 (s, 3H), 4,27 (q, 2H), 7,85-7,95 (m, 4H).

#### Etyl 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat

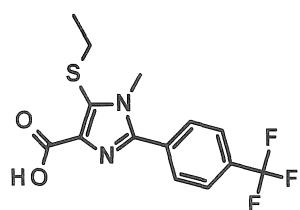


Bổ sung 6,0 g (96,7 mmol) etanethiol, 2,9 g (29,0 mmol) N,N-diisopropyletilamin (DIPEA), 1,5 g (1,5 mmol) sản phẩm cộng tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi(0)-clorofom [Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub> · CHCl<sub>3</sub>] và 1,7 g (2,9 mmol) Xantphos vào dung dịch chứa 4,1 g

(9,7 mmol) etyl 5-iodo-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat trong 1,4-dioxan (150 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 80°C qua đêm. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng này được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng và nước được bổ sung vào hỗn hợp này. Sau đó, hỗn hợp này được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien ete dầu mỏ / etyl axetat làm pha động.

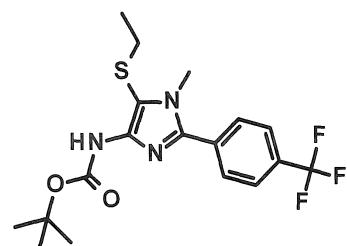
<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,15 (t, 3H), 1,31 (t, 3H), 2,92 (q, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,28 (q, 2H), 7,88-7,99 (m, 4H).

#### Axit 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylic



Bổ sung 0,69 g (17,3 mmol) natri hydroxit vào dung dịch chứa 3,1 g (8,7 mmol) etyl 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylat trong metanol (60 ml) và nước (60 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Dung dịch này được điều chỉnh đến độ pH = 3-4 bằng cách bổ sung nước axit clohydric đặc. Sau đó, hỗn hợp phản ứng này được chiết bằng hỗn hợp gồm clorofom/*i*-propanol (3:1). Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được sử dụng cho bước tổng hợp tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

#### Tert-butyl {5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-yl}carbamat

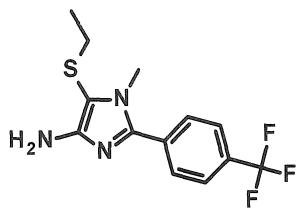


Bổ sung 4,5 g (16,4 mmol) diphenyl azidophosphat (DPPA) và 3,9 g (38,2 mmol) trietylamin vào dung dịch chứa 3,6 g (10,9 mmol) axit 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-carboxylic trong *tert*-butanol (60 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 80°C qua đêm, được để nguội và cô dưới áp suất thấp. Sau đó, 100 ml nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết bằng etyl axetat. Các

pha hưu cơ gộp lại được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulfat, được lọc và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien etyl axetat/ete dầu mỏ làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,15 (t, 3H), 1,44 (s, 9H), 2,72 (q, 2H), 3,79 (s, 3H), 7,85-7,96 (m, 4H), 8,65 (s, 1H).

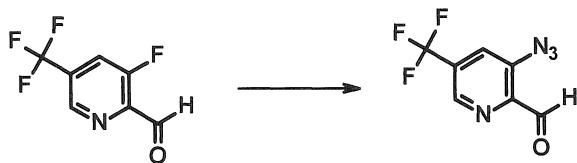
### 5-(Etylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-amin



Bổ sung 40 ml axit clohydric đặc vào dung dịch chứa 2,4 g (6,0 mmol) *tert*-butyl {5-(etylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-yl} carbamat trong dioxan (40 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm và sau đó, cô đén khô dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô này được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

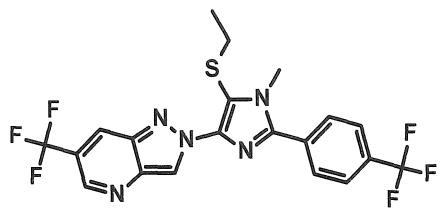
<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,15 (t, 3H), 2,58 (q, 2H), 3,68 (s, 3H), 4,81 (s, breit, 2H), 7,80-7,92 (m, 4H).

### 3-Azido-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt



1 g (5,2 mmol) 3-flo-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt ban đầu được nạp trong 10 ml dimetylformamit (DMF) và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C. Sau đó, 0,34 g (5,2 mmol, đã được hòa tan trong 10 ml DMF) natri azit được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Phản ứng này được làm kết thúc bằng cách bổ sung 100 ml nước. Hỗn hợp này được chiết hai lần, mỗi lần bằng 100 ml etyl axetat. Các pha hưu cơ gộp lại được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulfat, được lọc và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô này được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

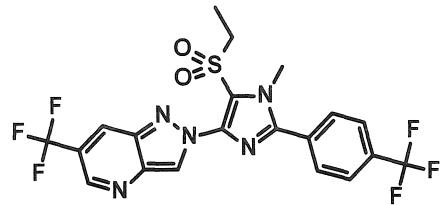
### 2-{5-(Etylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-yl}-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin



Bổ sung 290 mg (1,3 mmol) 3-azido-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt và 850 mg (2,99 mmol) titan isopropoxit vào dung dịch chứa 200 mg (0,66 mmol) 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-amin trongtoluen (15 ml). Hỗn hợp này được khuấy đầu tiên ở nhiệt độ 50°C trong 4 giờ và sau đó, ở nhiệt độ 100°C trong 1 giờ. Sau khi để nguội xuống nhiệt độ phòng, 100 ml nước được bổ sung vào và hỗn hợp được chiết bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ gộp lại được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulfat, được lọc và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm khô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien etyl axetat/etanol mỏ làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,10 (t, 3H), 2,90 (q, 2H), 3,93 (s, 3H), 7,94-7,96 (m, 2H), 8,08-8,11 (m, 2H), 8,82 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 9,34 (s, 1H).

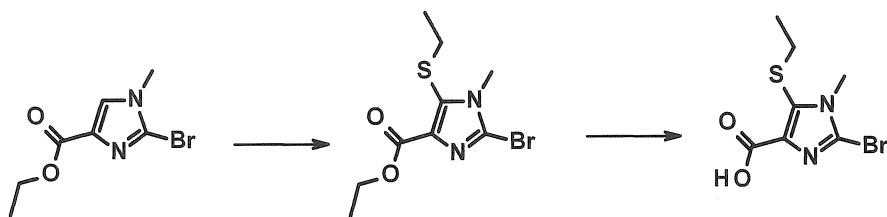
**2-{5-(Etylsulfonyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-yl}-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin (I-098)**



Dung dịch chứa 130 mg (0,28 mmol) 2-{5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-2-[4-(triflometyl)phenyl]-1H-imidazol-4-yl}-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin trong diclometan (20 ml) được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C và 100 mg (1,2 mmol, 35% trong nước) hydro peroxit và 100 mg (2,9 mmol) axit formic được bổ sung vào. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 5 giờ, được pha loãng bằng cách bổ sung 50 ml diclometan và sau đó, được rửa bằng dung dịch natri thiosulfat bão hòa và dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa. Pha hữu cơ được tách ra, làm khô bằng natri sulfat, lọc, và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm khô được tinh chế bằng HPLC điều chế sử dụng gradien nước / axetonitril làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 3,79 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 7,98-8,00 (m, 2H), 8,06-8,09 (m, 2H), 8,84 (s, 1H), 8,93 (s, 1H), 9,36 (s, 1H).

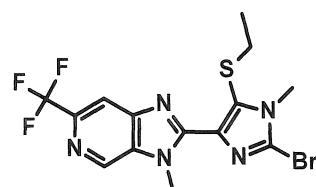
**Axit 2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic**



31 g (134 mmol) etyl 2-bromo-1-methyl-1H-imidazol-4-carboxylat và 24,4 g (200 mmol) dietyl disulfua được hòa tan trong 620 ml tetrahydrofuran và được làm lạnh xuống nhiệt độ -78°C. Bổ sung theo từng giọt 100 ml (2M trong THF, 200 mmol) lithi diisopropylamit (LDA) vào dung dịch này và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ -78°C trong 30 phút. Phản ứng này được làm kết thúc bằng cách bỏ sung dung dịch amoni clorua bão hòa. Các pha được tách ra và pha nước được chiết ba lần, mỗi lần bằng 300 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng magie sulphat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien ete dầu mỏ / etyl axetat làm pha động. Quá trình này thu được 28,5 g (97,3 mmol) etyl 2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-carboxylat. Hợp chất này được hòa tan trong 300 ml metanol và dung dịch này được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C. Sau đó, 300 ml (2N trong nước, 600 mmol) natri hydroxit được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 1 giờ. Hỗn hợp này được cô trên máy cô quay và được trung hòa bằng cách bỏ sung dung dịch HCl 1N. Hỗn hợp này được chiết bằng etyl axetat. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và hợp chất đích thu được.

<sup>1</sup>H-NMR(300 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,09 (t, 3H), 2,86 (q, 2H), 3,64 (s, 3H), 12,60 (s, 1H).

**2-[2-Bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-010)**

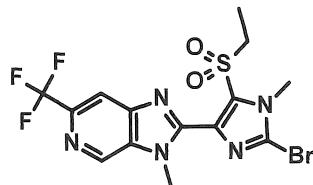


Bổ sung 5,00 g (26,1 mmol) N<sup>3</sup>-metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin và 5,01 g (26,1 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydrochlorua (EDCI) vào dung dịch chứa 9,02 g (34,0 mmol) axit 2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic trong pyridin (50 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong ba ngày. Tiếp theo, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được thẩm trong etyl axetat (50 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 100°C

trong 6 giờ, để nguội xuống nhiệt độ trong phòng, tạo huyền phù đặc bằng nước, sau đó, được lọc qua màng lọc Nutsche, làm khô và hợp chất đích thu được từ đó.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,11 (t, 3H), 3,00 (q, 2H), 3,76 (s, 3H), 4,15 (s, 3H), 8,19 (s, 1H), 9,15 (s, 1H).

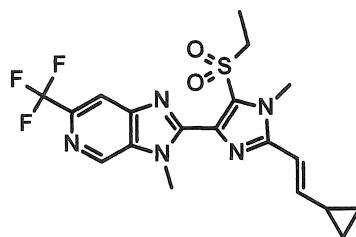
**2-[2-Bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]-3-methyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-004)**



Bổ sung 4,64 ml (122 mmol) axit formic và 15,1 ml (172 mmol, 35% trong nước) hydro peroxit vào dung dịch chứa 10,3 g (24,5 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]-3-methyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin trong diclometan (100 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm và phản ứng được làm kết thúc bằng cách bổ sung dung dịch natri thiosulfat bão hòa. Pha hữu cơ được tách ra, được làm khô bằng natri sulfat, lọc, và hợp chất đích thu được từ đó.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,74 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 8,24 (s, 1H), 9,22 (s, 1H).

**2-{2-[*(E*)-2-Cyclopropylvinyl]-5-(ethylsulfonyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl}-3-methyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-007)**

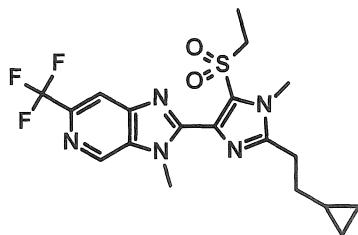


150 mg (0,33 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]-3-methyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (**I-004**), 64,4 mg (0,33 mmol) 2-[*(E*)-2-cyclopropylvinyl]-4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan và 11,5 mg (0,01 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi ban đầu được nạp trong môi trường khí bảo vệ. Sau đó, 2,6 ml dioxan đã được loại khí và 1,3 ml dung dịch natri cacbonat (1M) đã được loại khí được bổ sung vào. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 92°C qua đêm. Sau khi để nguội, dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Cặn được thám trong diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được tách ra, làm khô bằng magie

sulfat, lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng građien xyclohexan / axeton làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 0,64-0,68 (m, 2H), 0,90-0,95 (m, 2H), 1,24 (t, 3H), 1,73-1,77 (m, 1H), 3,65 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 6,38-6,44 (m, 1H), 6,75 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 9,20 (s, 1H).

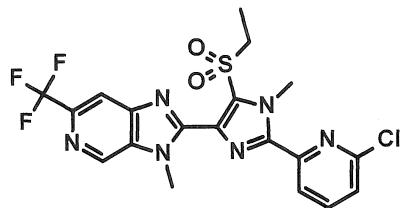
**2-[2-(2-Xcyclopropyletyl)-5-(etyl sulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-085)**



179 mg (0,40 mmol) 2-{2-[(E)-2-xcyclopropylvinyl]-5-(etyl sulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl}-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (**I-007**) trong 10 ml metanol ban đầu được nạp vào trong nồi hấp. Sau đó, 50 mg (0,04 mmol, 10%) paladi trên cacbon được bổ sung vào và hỗn hợp được khuấy trong môi trường khí hydro ở áp suất 5 bar (500 kPa) trong 16 giờ. Sau khi cân bằng áp suất và loại bỏ môi trường khí hydro, hỗn hợp này được lọc qua xelit và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng građien xyclohexan / axeton làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 0,04-0,08 (m, 2H), 0,40-0,44 (m, 2H), 0,80-0,85 (m, 1H), 1,26 (t, 3H), 1,64-1,70 (m, 2H), 2,94 (t, 2H), 3,69 (q, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 8,21 (s, 1H), 9,19 (s, 1H).

**2-[2-(6-clopyridin-2-yl)-5-(etyl sulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-014)**

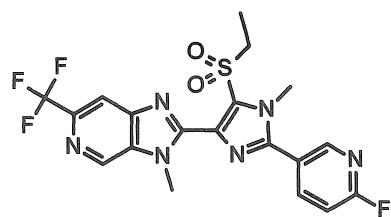


Trong môi trường khí bảo vệ, 200 mg (0,44 mmol) 2-[2-bromo-5-(etyl sulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (**I-004**), 267 mg (0,66 mmol) 2-clo-6-(tributylstannyl)pyridin, 56 mg (1,32 mmol) lithi clorua, 8 mg (0,04 mmol) đồng(I) iodua và 102 mg (0,08 mmol)

tetrakis(triphenylphosphin)paladi ban đầu được nạp trong dioxan đã được loại khí (4 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 96°C qua đêm. Sau khi để nguội, hỗn hợp này được pha loãng bằng diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được làm khô bằng magie sulfat, lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng građien nước / axetonitril làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,30 (t, 3H), 3,78 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 4,32 (s, 3H), 7,74 (d, 1H), 8,09-8,13 (m, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,26 (s, 1H), 9,23 (s, 1H).

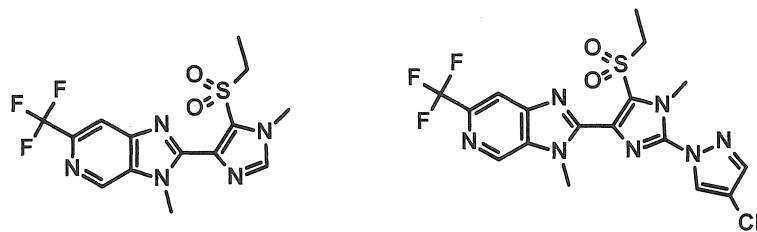
**2-[5-(Etylsulfonyl)-2-(6-flopyridin-3-yl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-019)**



Trong môi trường khí bảo vệ, 200 mg (0,44 mmol) 2-[2-bromo-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-004), 62 mg (0,44 mmol) axit (6-flopyridin-3-yl)boronic và 15 mg (0,01 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi ban đầu được nạp trong hỗn hợp gồm dioxan đã được loại khí (4 ml) và dung dịch nước natri cacbonat đã được loại khí (1M, 1,8 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 96°C qua đêm. Sau khi để nguội, hỗn hợp này được pha loãng bằng diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được làm khô bằng magie sulfat, lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng građien xyclohexan / axeton làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 3,98 (s, 3H), 4,02 (s, 3H), 7,45-7,48 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,44-8,48 (m, 1H), 8,71-8,72 (m, 1H), 9,23 (s, 1H).

**2-[5-(Etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-029) và 2-[2-(4-clo-1H-pyrazol-1-yl)-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-027)**

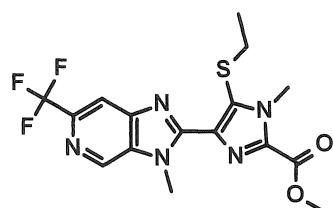


Trong môi trường khí bảo vệ, 200 mg (0,44 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]-3-methyl-6-(triflomethyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-004), 45 mg (0,44 mmol) 4-clo-1H-pyrazol, 4 mg (0,02 mmol) đồng(I) iodua, 128 mg (0,92 mmol) kali cacbonat và 13 mg (0,08 mmol) *trans*-N,N'-dimethylxyclohexan-1,2-diamin (raxemic) ban đầu được nạp trong dioxan đã được loại khí (2 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 96°C qua đêm. Sau khi để nguội, hỗn hợp này được pha loãng bằng diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được làm khô bằng magie sulfat, lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tách ra và được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien nước / axetonitril làm dung môi rửa giải.

I-029:  $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,80 (q, 2H), 3,97 (s, 3H), 3,99 (s, 3H), 8,23 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 9,21 (s, 1H).

I-027:  $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,83 (q, 2H), 3,99 (s, 3H), 4,01 (s, 3H), 8,17 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 9,24 (s, 1H).

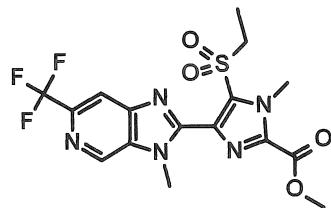
### Metyl 5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-4-[3-methyl-6-(triflomethyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxylat (I-035)



4,58 g (10,8 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]-3-methyl-6-(triflomethyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-010) trong metanol (458 ml) ban đầu được nạp trong bình hấp dung tích 600 ml. Sau đó, 1,67 g (20,3 mmol) natri axetat và 861 mg (1,09 mmol) phúc hợp diclo[(bisdiphenylphosphino)feroxenyl]paladi(II)-axeton được bỏ sung vào. Hỗn hợp phản ứng này được carbonyl hóa trong môi trường cacbon monoxid ở áp suất 5 bar (500 kPa) và 50°C trong 24 giờ. Sau khi để nguội xuống nhiệt độ phòng, cân bằng áp suất và loại bỏ môi trường cacbon monoxid, hỗn hợp này được lọc qua xelit và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien xyclohexan / axeton làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,10 (t, 3H), 3,04 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 4,08 (s, 3H), 4,18 (s, 3H), 8,22 (s, 1H), 9,17 (s, 1H).

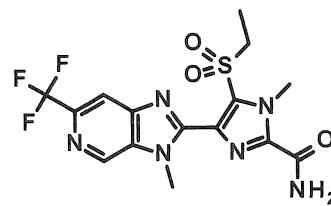
**Metyl 5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxylat (I-036)**



Bổ sung 0,7 ml (17,2 mmol) axit formic và 2,1 ml (24,1 mmol, 35% trong nước) hydro peroxit vào dung dịch chứa 1,60 g (3,44 mmol) methyl 5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxylat (I-035) trong diclometan (80 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm và phản ứng được làm kết thúc bằng cách bổ sung dung dịch natri thiosulfat bão hòa. Pha hữu cơ được tách ra, làm khô bằng natri sulfat, lọc và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm khô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien cyclohexan / axeton làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,76 (q, 2H), 3,93 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 4,24 (s, 3H), 8,26 (s, 1H), 9,23 (s, 1H).

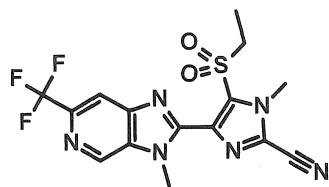
**5-(Etylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxamit (I-038)**



Bổ sung 474 mg (6,95 mmol, 25%) amoniac vào dung dịch chứa 300 mg (0,69 mmol) methyl 5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxylat (I-036) trong metanol (15 ml) và tetrahydrofuran (15 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm và sản phẩm thu được bằng cách cô hồn hợp đến khô dưới áp suất thấp.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,75 (q, 2H), 3,98 (s, 3H), 4,28 (s, 3H), 8,02 (s, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,33 (s, 1H), 9,24 (s, 1H).

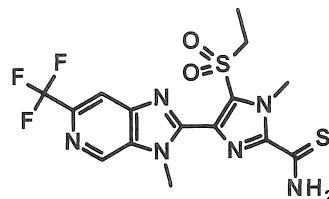
**5-(Etylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carbonitril (I-045)**



Dung dịch chứa 100 mg (0,24 mmol) 5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxamit (**I-038**) trong phosphoryl clorua (2 ml) được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong ba ngày và sau đó, cô đến khô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien nước / axetonitril làm dung môi rửa giải.

<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,30 (t, 3H), 3,86 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 4,09 (s, 3H), 8,28 (s, 1H), 9,25 (s, 1H).

**5-(Etylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carbothioamit (**I-046**)**



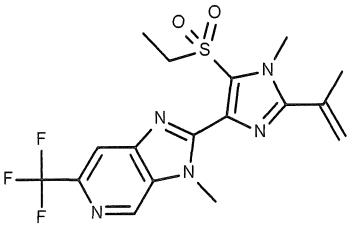
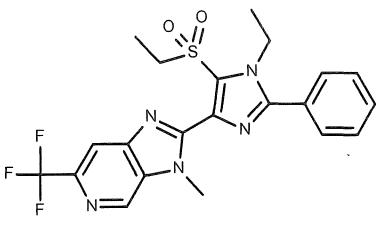
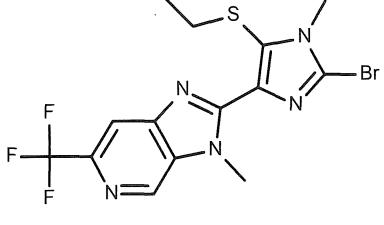
Trong môi trường khí bảo vệ, 107 mg (0,26 mmol) 2,4-bis(4-methoxyphenyl)-1,3,2,4-dithiadiphosphetan 2,4-disulfua (chất phản ứng Lawesson) được bỏ sang vào dung dịch chứa 100 mg (0,24 mmol) 5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-carboxamit (**I-038**) trong toluen (1 ml). Hỗn hợp này được làm nóng đến sôi trong 4 giờ, được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng và được cô dưới áp suất thấp. Cặn được thâm trong diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được tách ra, làm khô bằng magie sulfat, lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách tinh chế bằng sắc ký cột sử dụng gradien nước / axetonitril làm dung môi rửa giải.

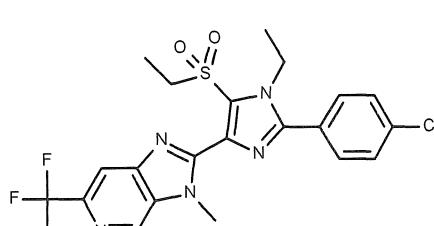
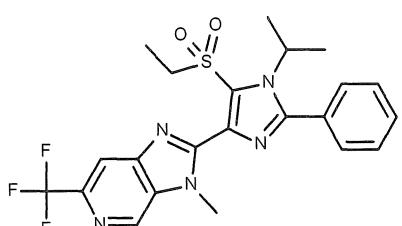
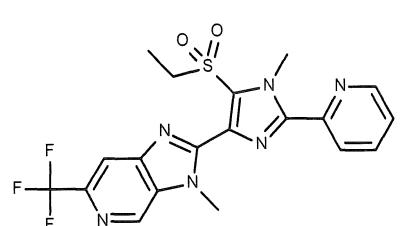
<sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,29 (t, 3H), 3,81 (q, 2H), 3,99 (s, 3H), 4,14 (s, 3H), 8,25 (s, 1H), 9,23 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 10,60 (s, 1H).

Tương tự như các ví dụ và theo các quy trình điều chế được mô tả trên đây, các hợp chất có công thức (I) sau có thể thu được:

| Ví dụ | Cấu trúc | Dữ liệu NMR  |
|-------|----------|--|
| I-001 |          | I-001: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2252 (4,0); 8,2462 (4,2); 4,3983 (0,7); 4,3809 (2,5); 4,3630 (2,5); 4,3454 (0,7); 3,9902 (1,0); 3,9806 (16,0); 3,8342 (1,0); 3,8155 (3,4); 3,7971 (3,5); 3,7785 (1,0); 3,3207 (58,6); 2,6751 (0,6); 2,6710 (0,8); 2,6666 (0,6); 2,5239 (1,8); 2,5062 (103,1); 2,5018 (132,5); 2,4974 (94,1); 2,3328 (0,6); 2,3285 (0,8); 2,3241 (0,6); 2,0859 (1,6); 1,4434 (2,8); 1,4256 (6,4); 1,4079 (2,8); 1,3981 (0,6); 1,2976 (3,6); 1,2791 (8,0); 1,2606 (3,6); -0,0002 (2,5)   |
| I-002 |          | I-002: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2149 (4,0); 8,2339 (4,1); 5,7577 (3,7); 5,3553 (0,4); 5,3391 (0,5); 5,3230 (0,4); 3,9373 (0,8); 3,9233 (16,0); 3,7686 (0,9); 3,7018 (0,9); 3,6835 (3,1); 3,6650 (3,1); 3,6466 (1,0); 3,3216 (11,2); 2,6711 (0,4); 2,5241 (0,8); 2,5105 (21,8); 2,5064 (45,3); 2,5019 (60,5); 2,4975 (43,6); 2,4932 (21,0); 2,3284 (0,3); 1,7121 (13,2); 1,6946 (13,1); 1,6838 (1,2); 1,6768 (0,8); 1,6592 (0,7); 1,3113 (0,4); 1,3014 (3,7); 1,2926 (0,8); 1,2831 (8,2); 1,2645 (3,6); 0,0080 (0,4); -0,0002 (10,9); -0,0082 (0,4)   |
| I-003 |          | I-003: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2238 (3,8); 8,2524 (4,0); 7,8336 (1,9); 7,8272 (2,0); 7,8222 (1,8); 7,8185 (2,4); 7,8096 (2,2); 7,6269 (0,6); 7,6176 (4,8); 7,6103 (4,4); 7,6015 (3,5); 4,0147 (16,0); 3,9689 (14,7); 3,8366 (1,0); 3,8183 (3,3); 3,7998 (3,3); 3,7813 (1,0); 3,3211 (76,3); 2,6747 (0,7); 2,6704 (1,0); 2,6660 (0,7); 2,5237 (2,5); 2,5102 (65,5); 2,5059 (131,9); 2,5014 (170,9); 2,4969 (121,6); 2,4926 (57,9); 2,3327 (0,7); 2,3280 (1,0); 2,3239 (0,7); 2,0857 (2,3); 1,3976 (1,1); 1,3433 (3,6); 1,3248 (8,1); 1,3063 (3,5); 0,0079 (0,7); -0,0001 (19,4); -0,0083 (0,7) |

|       |  |   |
|-------|--|---|
| I-004 |  | I-004: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2198 (3,9); 8,2438 (4,2); 5,7557 (3,7); 3,9590 (16,0); 3,9230 (15,3); 3,9115 (0,9); 3,8423 (0,7); 3,8249 (0,8); 3,8058 (0,6); 3,7669 (1,1); 3,7484 (3,5); 3,7299 (3,5); 3,7115 (1,1); 3,3226 (12,4); 2,6711 (0,3); 2,5067 (48,0); 2,5023 (61,6); 2,4979 (43,8); 2,3290 (0,4); 1,2911 (3,7); 1,2727 (8,2); 1,2542 (3,7); 1,2065 (0,5); 1,1829 (0,5); 0,0077 (1,0); -0,0002 (22,7); -0,0084 (0,9)   |
| I-005 |  | I-005: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2227 (3,5); 8,2512 (3,8); 7,9251 (1,1); 7,8688 (3,3); 7,8476 (4,1); 7,8155 (0,4); 7,6925 (4,2); 7,6712 (3,3); 7,5936 (0,4); 7,5718 (0,4); 4,0299 (1,6); 4,0200 (1,6); 4,0087 (12,7); 3,9628 (11,9); 3,8289 (1,0); 3,8194 (0,4); 3,8090 (2,9); 3,7904 (2,9); 3,7717 (0,9); 3,3197 (71,6); 2,6748 (1,6); 2,6701 (2,0); 2,5233 (5,1); 2,5056 (272,2); 2,5013 (357,5); 2,4970 (260,8); 2,3281 (2,0); 2,3238 (1,5); 1,3976 (16,0); 1,3557 (0,5); 1,3406 (3,2); 1,3223 (6,7); 1,3039 (2,9); -0,0003 (11,3)  |
| I-006 |  | I-006: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2126 (3,7); 8,2339 (4,0); 7,0471 (1,1); 7,0195 (1,2); 7,0048 (1,4); 6,9770 (1,4); 6,3732 (1,5); 6,3692 (1,5); 6,3309 (1,3); 6,3267 (1,2); 5,7904 (1,5); 5,7862 (1,4); 5,7629 (1,3); 5,7589 (1,4); 3,9705 (14,8); 3,9597 (16,0); 3,7234 (0,9); 3,7047 (3,3); 3,6862 (3,4); 3,6676 (1,0); 3,3193 (83,1); 2,6742 (1,8); 2,6698 (2,4); 2,6652 (1,8); 2,5233 (5,8); 2,5096 (158,0); 2,5054 (323,4); 2,5010 (427,3); 2,4965 (302,6); 2,4921 (142,4); 2,4433 (0,4); 2,4394 (0,4); 2,3323 (1,8); 2,3278 (2,4); 2,3232 (1,8); 2,0855 (0,8); 1,3976 (1,2); 1,2718 (3,6); 1,2535 (7,9); 1,2349 (3,6); 0,0082 (0,5); -0,0002 (15,4) |
| I-007 |  | I-007: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,1990 (4,0); 8,2199 (4,2); 6,7627 (2,2); 6,7246 (2,8); 6,4410 (1,4); 6,4163 (1,4); 6,4029 (1,1); 6,3782 (1,1); 3,9323 (16,0); 3,9230 (14,4); 3,6798 (1,0); 3,6613 (3,2); 3,6429 (3,3); 3,6246 (1,0); 3,3239 (13,2); 2,5249 (0,4); 2,5111 (12,1); 2,5070 (25,0); 2,5026 (32,9);   |

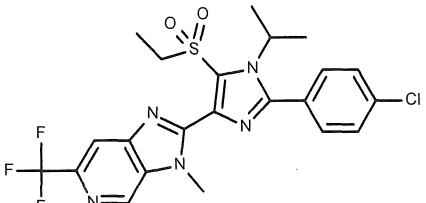
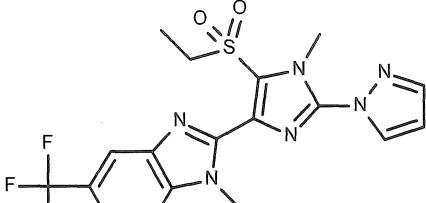
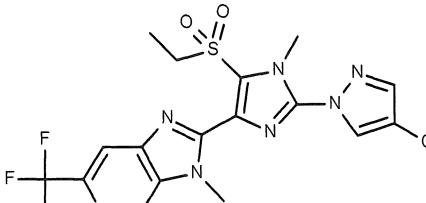
|       |   |   |
|-------|---|---|
|       |   | 2,4982 (23,6); 2,0864 (9,5); 1,7726 (0,4);<br>1,7628 (0,6); 1,7505 (0,6); 1,7383 (0,6);<br>1,7285 (0,4); 1,2560 (3,6); 1,2375 (7,9);<br>1,2191 (3,4); 0,9453 (0,5); 0,9344 (1,7);<br>0,9284 (1,9); 0,9146 (1,7); 0,9087 (1,8);<br>0,8988 (0,6); 0,6748 (0,7); 0,6645 (2,2);<br>0,6594 (2,0); 0,6537 (2,0); 0,6482 (2,2);<br>0,6375 (0,6); -0,0002 (1,3)   |
| I-008 |    | I-008: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2074 (3,2); 8,2281 (3,4); 5,7620<br>(2,0); 5,5708 (2,6); 3,9590 (15,7); 3,9559<br>(16,0); 3,7603 (0,8); 3,7418 (2,8); 3,7233<br>(2,9); 3,7048 (0,8); 3,3249 (18,0); 2,5069<br>(34,0); 2,5025 (44,1); 2,4980 (31,3);<br>2,1750 (8,0); 1,3973 (2,1); 1,2955 (3,1);<br>1,2771 (6,8); 1,2586 (3,0); -0,0002 (1,2)  |
| I-009 |  | I-009: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,3130 (0,4); 9,2253 (4,0); 8,3170<br>(0,4); 8,2511 (4,3); 7,8079 (0,4); 7,7986<br>(1,8); 7,7934 (2,4); 7,7839 (2,4); 7,7743<br>(2,5); 7,6264 (5,2); 7,6212 (4,8); 7,6128<br>(2,8); 7,6099 (2,7); 7,6001 (0,8); 7,5848<br>(0,4); 6,7556 (0,4); 4,4391 (0,8); 4,4217<br>(2,4); 4,4034 (2,4); 4,3849 (0,8); 4,0574<br>(0,4); 4,0416 (16,0); 3,9029 (0,9); 3,8841<br>(3,3); 3,8654 (3,4); 3,8476 (1,1); 3,3224<br>(556,8); 3,2801 (0,5); 3,2713 (0,3);<br>2,7960 (0,4); 2,6748 (2,7); 2,6702 (3,6);<br>2,6662 (2,7); 2,6014 (0,4); 2,5908 (0,4);<br>2,5234 (9,8); 2,5098 (242,5); 2,5056<br>(497,9); 2,5012 (660,9); 2,4967 (472,9);<br>2,4925 (226,2); 2,4320 (0,5); 2,3324<br>(2,7); 2,3276 (3,7); 2,3232 (2,9); 2,0855<br>(0,4); 1,3975 (7,6); 1,3462 (3,7); 1,3357<br>(3,2); 1,3279 (8,6); 1,3183 (6,8); 1,3094<br>(4,2); 1,3001 (2,8); -0,0003 (9,1) |
| I-010 |  | I-010: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,1511 (3,2); 8,1914 (3,5); 7,4806<br>(2,7); 7,4604 (3,0); 7,1198 (2,4); 7,1003<br>(2,1); 4,1488 (16,0); 4,0780 (2,0); 4,0728<br>(2,0); 4,0610 (2,0); 3,9789 (0,4); 3,9691<br>(0,3); 3,7605 (14,4); 3,6389 (1,2); 3,5999<br>(0,9); 3,0286 (1,2); 3,0102 (3,8); 2,9918<br>(3,9); 2,9734 (1,2); 2,6757 (0,4); 2,6711<br>(0,6); 2,6665 (0,5); 2,6620 (0,4); 2,5243<br>(1,3); 2,5195 (2,1); 2,5108 (40,7); 2,5064<br>(85,7); 2,5019 (114,5); 2,4973 (81,2);<br>2,4929 (38,0); 2,3332 (0,5); 2,3286 (0,7);  |

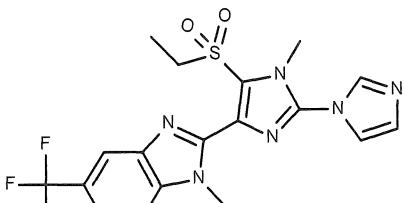
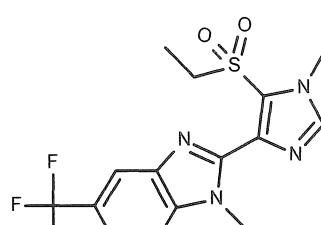
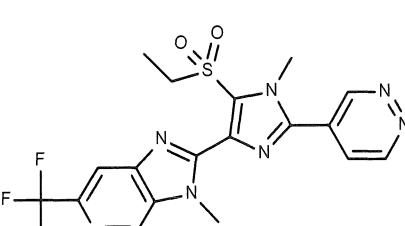
|       |   |  |
|-------|---|--|
|       |   | 2,3240 (0,5); 2,2875 (9,0); 1,2350 (0,3); 1,1230 (4,1); 1,1144 (0,6); 1,1046 (8,9); 1,0862 (4,1); 1,0701 (0,4); 0,0080 (0,9); -0,0002 (29,8); -0,0084 (1,0)  |
| I-011 |  <p>Chemical structure of compound I-011: 2-(4-chlorophenyl)-5-(2-(2,2,2-trifluoroethyl)hexylsulfonyl)-4-methyl-3-pyridylmethylimidazole.</p>                      | I-011: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,6529 (0,3); 9,2242 (3,9); 8,2496 (4,4); 7,8575 (0,3); 7,8422 (3,5); 7,8211 (4,7); 7,7000 (4,7); 7,6785 (3,5); 7,1755 (0,3); 4,4313 (0,8); 4,4132 (2,3); 4,3953 (2,2); 4,3791 (0,7); 4,0585 (0,5); 4,0366 (14,0); 3,8951 (1,1); 3,8775 (3,1); 3,8591 (3,1); 3,8419 (1,0); 3,3660 (0,4); 3,3210 (247,6); 2,6704 (3,5); 2,5054 (493,7); 2,5013 (632,5); 2,4970 (457,0); 2,4121 (0,5); 2,3279 (3,7); 1,3977 (16,0); 1,3447 (3,8); 1,3380 (3,1); 1,3266 (8,3); 1,3199 (6,5); 1,3080 (4,1); 1,3026 (3,0); 1,2381 (0,4); 1,1623 (0,4); -0,0002 (7,9); -3,5554 (0,4) |
| I-012 |  <p>Chemical structure of compound I-012: 2-(4-chlorophenyl)-5-(2-(2,2,2-trifluoroethyl)hexylsulfonyl)-4,4-dimethyl-3-pyridylmethylimidazole.</p>                | I-012: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2102 (4,5); 8,2355 (5,0); 7,6806 (2,7); 7,6643 (3,6); 7,6604 (3,3); 7,6397 (0,5); 7,6202 (1,7); 7,5980 (4,5); 7,5792 (3,0); 7,5619 (0,8); 5,1080 (0,4); 5,0899 (0,8); 5,0727 (1,1); 5,0541 (0,8); 5,0380 (0,4); 3,9696 (16,0); 3,9373 (0,8); 3,8274 (1,1); 3,8093 (3,5); 3,7906 (3,5); 3,7717 (1,1); 3,3205 (82,5); 2,6707 (2,0); 2,5057 (290,3); 2,5018 (356,2); 2,4980 (261,7); 2,3285 (2,1); 1,6768 (0,6); 1,6599 (0,6); 1,4621 (11,6); 1,4446 (11,3); 1,3984 (2,4); 1,3464 (3,9); 1,3279 (8,0); 1,3093 (3,8); 1,2935 (0,5); 1,2745 (0,4); 0,0001 (3,3)   |
| I-013 |  <p>Chemical structure of compound I-013: 2-(4-chlorophenyl)-5-(2-(2,2,2-trifluoroethyl)hexylsulfonyl)-4-methyl-3-pyridylmethylimidazole-5-nitro derivative.</p> | I-013: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2380 (5,1); 8,7929 (0,9); 8,2597 (5,5); 8,1737 (0,9); 8,0673 (1,1); 8,0484 (1,9); 8,0295 (0,9); 7,5984 (1,2); 5,7570 (3,6); 4,3529 (16,0); 4,0056 (13,1); 3,8065 (1,3); 3,7881 (4,0); 3,7696 (4,1); 3,7512 (1,3); 3,3210 (15,0); 2,6707 (0,9); 2,5060 (132,9); 2,5022 (163,4); 2,4984 (125,2); 2,3289 (0,9); 1,3200 (4,4); 1,3016 (9,3); 1,2833 (4,3); -0,0002 (32,2)  |

|       |  |  |
|-------|--|--|
| I-014 |  | I-014: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2382 (3,6); 8,2618 (3,9); 8,1909 (1,6); 8,1716 (2,7); 8,1252 (1,6); 8,1056 (2,6); 8,0860 (1,1); 7,7476 (2,2); 7,7280 (2,0); 4,3197 (12,7); 3,9948 (13,4); 3,8026 (0,9); 3,7843 (2,9); 3,7658 (2,9); 3,7474 (0,9); 3,3218 (11,0); 2,6715 (0,3); 2,5066 (46,0); 2,5024 (59,6); 2,4982 (42,9); 2,3289 (0,3); 2,0862 (16,0); 1,3162 (3,1); 1,2978 (6,9); 1,2794 (3,1); 0,0079 (0,8); -0,0002 (23,2)  |
| I-015 |  | I-015: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2391 (4,5); 8,8599 (2,2); 8,2600 (4,7); 8,2207 (0,7); 8,1987 (3,4); 8,1908 (3,6); 8,1857 (2,9); 8,1695 (0,8); 8,1637 (0,7); 5,7572 (2,4); 4,3271 (15,7); 4,0021 (16,0); 3,8083 (1,2); 3,7895 (3,7); 3,7710 (3,7); 3,7527 (1,3); 3,3214 (12,0); 2,6712 (0,6); 2,5063 (99,7); 2,5021 (115,7); 2,3289 (0,6); 1,3177 (4,1); 1,2992 (8,8); 1,2809 (4,2); 1,2330 (0,3); 0,8787 (0,5); 0,8599 (0,9); 0,8418 (0,4); -0,0002 (22,9)   |
| I-016 |  | I-016: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2298 (3,8); 9,0179 (2,0); 9,0139 (2,0); 8,7983 (1,3); 8,7946 (1,4); 8,7862 (1,4); 8,7825 (1,4); 8,2796 (0,9); 8,2749 (1,3); 8,2700 (0,9); 8,2560 (5,1); 8,2504 (1,1); 7,6634 (1,1); 7,6511 (1,2); 7,6449 (1,2); 7,6313 (1,2); 4,0238 (16,0); 3,9926 (14,6); 3,8476 (1,0); 3,8292 (3,2); 3,8107 (3,4); 3,7922 (1,0); 3,3393 (38,5); 3,3353 (35,9); 2,5256 (0,6); 2,5121 (14,0); 2,5079 (28,5); 2,5034 (37,6); 2,4989 (26,9); 2,4946 (12,8); 2,0868 (2,1); 1,3539 (3,6); 1,3354 (8,1); 1,3169 (3,5); 0,0079 (0,7); -0,0002 (18,4); -0,0085 (0,6) |
| I-017 |  | I-017: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2312 (3,7); 9,2143 (0,8); 8,9740 (2,3); 8,9490 (2,2); 8,8890 (1,3); 8,8745 (1,3); 8,8688 (1,3); 8,8547 (1,1); 8,2605 (4,0); 8,2407 (0,8); 8,1279 (0,4); 7,6866 (1,2); 7,6722 (1,2); 7,6614 (1,2); 7,6468 (1,2); 4,0277 (14,2); 4,0130 (2,9); 3,9003 (1,0); 3,8760 (8,3); 3,8732 (8,0); 3,8633 (3,4); 3,8444 (1,0); 3,8117 (0,6); 3,7930 (0,6); 3,7738 (2,8); 3,5678 (0,7); 3,3197 (31,4); 2,6708 (1,2); 2,5538 (0,4); 2,5058 (164,9); 2,5014 (213,3); 2,4971 (152,7);  |

|       |  |   |
|-------|--|---|
|       |  | 2,3327 (0,9); 2,3282 (1,2); 2,1171 (0,5);<br>2,0857 (16,0); 1,3516 (3,4); 1,3332 (7,2);<br>1,3147 (3,3); 1,3022 (1,5); 1,2838 (0,7);<br>1,2325 (0,4); 1,1401 (1,1); -0,0002 (6,1)   |
| I-018 |  | I-018: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2336 (3,4); 8,9027 (1,6); 8,8989 (2,7); 8,8954 (1,5); 8,8352 (2,4); 8,8283 (2,5); 8,2784 (0,8); 8,2739 (1,0); 8,2715 (1,0); 8,2671 (0,9); 8,2594 (3,7); 8,2502 (1,1); 8,2477 (1,0); 8,2434 (0,8); 4,0247 (14,1); 4,0095 (13,0); 3,8553 (0,8); 3,8368 (2,8); 3,8183 (2,9); 3,7998 (0,9); 3,3232 (43,6); 2,6709 (0,4); 2,5244 (0,9); 2,5108 (24,0); 2,5064 (49,4); 2,5020 (65,1); 2,4974 (46,3); 2,4931 (22,0); 2,3287 (0,4); 2,0861 (16,0); 1,3563 (3,1); 1,3379 (7,0); 1,3194 (3,0); 0,0080 (1,0); -0,0002 (31,4); -0,0085 (1,2)                             |
| I-019 |  | I-019: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2287 (3,9); 8,7155 (2,2); 8,7095 (2,2); 8,4838 (0,8); 8,4775 (0,8); 8,4630 (1,3); 8,4567 (1,2); 8,4430 (0,8); 8,4367 (0,8); 8,2555 (4,2); 7,4791 (1,3); 7,4727 (1,3); 7,4576 (1,4); 7,4509 (1,3); 5,7571 (7,6); 4,0202 (16,0); 3,9776 (15,0); 3,9666 (0,8); 3,8441 (1,1); 3,8257 (3,4); 3,8072 (3,4); 3,7887 (1,0); 3,5682 (0,5); 3,3238 (28,0); 2,5248 (0,8); 2,5112 (19,0); 2,5069 (38,3); 2,5024 (50,1); 2,4979 (35,2); 2,4936 (16,4); 2,0863 (12,6); 1,3970 (4,4); 1,3527 (3,7); 1,3343 (8,3); 1,3158 (3,6); 0,0078 (1,9); -0,0002 (52,1); -0,0085 (1,9) |
| I-020 |  | I-020: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2286 (4,4); 8,5346 (1,5); 8,5239 (1,5); 8,4136 (0,8); 8,4093 (0,7); 8,3946 (1,0); 8,3901 (1,5); 8,3712 (0,8); 8,3663 (0,7); 8,2586 (4,8); 7,6637 (0,9); 7,6597 (0,9); 7,6464 (1,4); 7,6411 (0,9); 7,6327 (0,9); 7,6287 (0,8); 5,7576 (3,8); 4,0216 (16,0); 3,8934 (1,1); 3,8711 (11,1); 3,8568 (3,8); 3,8383 (1,2); 3,3211 (8,1); 2,6712 (0,3); 2,5063 (46,0); 2,5023 (57,6); 2,4982 (41,5); 1,3500 (3,8); 1,3316 (8,1); 1,3131 (3,6); -0,0002 (3,7)   |

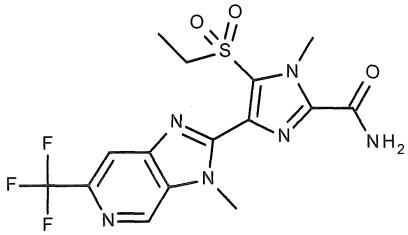
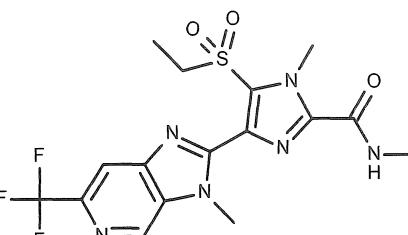
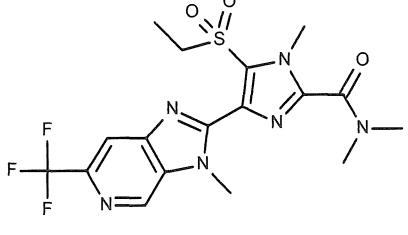
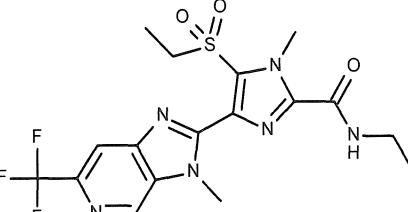
|       |  |  |
|-------|--|--|
| I-021 |  | I-021: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2324 (3,7); 8,8336 (3,3); 8,8188 (3,2); 8,7363 (0,3); 8,2594 (4,0); 7,8561 (3,7); 7,8525 (2,3); 7,8411 (3,8); 7,8317 (0,3); 7,8269 (0,4); 4,0294 (13,0); 4,0145 (13,8); 3,8476 (1,0); 3,8292 (3,0); 3,8107 (3,0); 3,7922 (0,9); 3,3240 (9,0); 2,5070 (30,7); 2,5027 (39,5); 2,4983 (28,0); 2,0864 (16,0); 1,3492 (3,2); 1,3308 (7,1); 1,3123 (3,2); 0,0077 (0,6); -0,0002 (17,3); -0,0085 (0,6)  |
| I-022 |  | I-022: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2357 (4,0); 8,5035 (2,4); 8,4906 (2,5); 8,2620 (4,3); 7,8315 (1,6); 7,8224 (1,1); 7,8187 (1,5); 7,8149 (1,0); 7,6839 (2,9); 4,0455 (14,9); 4,0151 (16,0); 3,8530 (1,0); 3,8345 (3,4); 3,8159 (3,4); 3,7973 (1,2); 3,3245 (76,2); 2,6755 (0,4); 2,6709 (0,5); 2,6666 (0,4); 2,5241 (1,5); 2,5106 (36,4); 2,5064 (73,1); 2,5020 (95,8); 2,4975 (68,1); 2,4933 (32,4); 2,3331 (0,4); 2,3289 (0,6); 1,3511 (3,6); 1,3327 (8,2); 1,3142 (3,6); -0,0002 (9,6); -0,0083 (0,4)   |
| I-023 |  | I-023: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,4033 (5,5); 9,2790 (12,1); 9,2360 (3,8); 8,2618 (4,1); 4,0338 (15,2); 4,0290 (16,0); 3,9942 (0,7); 3,9648 (0,4); 3,8588 (0,9); 3,8404 (3,1); 3,8218 (3,1); 3,8035 (1,0); 3,3225 (17,3); 2,5245 (0,8); 2,5066 (43,2); 2,5022 (56,3); 2,4979 (40,0); 2,0861 (12,2); 1,3593 (3,3); 1,3409 (7,4); 1,3225 (3,2); 0,0079 (0,8); -0,0002 (23,5); -0,0083 (0,8)  |
| I-024 |  | I-024: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2120 (4,6); 8,2319 (4,9); 3,9600 (16,0); 3,9415 (15,1); 3,8008 (1,2); 3,7824 (3,8); 3,7639 (3,8); 3,7456 (1,2); 3,3197 (31,4); 2,6706 (0,4); 2,5019 (65,6); 2,3287 (0,4); 2,0859 (1,6); 1,7846 (0,4); 1,7717 (0,7); 1,7637 (0,8); 1,7513 (1,5); 1,7389 (0,9); 1,7309 (0,8); 1,7181 (0,4); 1,2784 (3,9); 1,2600 (8,2); 1,2416 (3,9); 1,0626 (0,8); 1,0514 (2,1); 1,0443 (3,0); 1,0311 (2,3); 1,0240 (2,6); 1,0151 (1,1); 0,9799 (0,3); 0,9445 (1,1); 0,9352 (3,0); 0,9293 (3,0); 0,9237 (3,2); 0,9168 (2,7); 0,9057 (0,8); -0,0002 (37,9) |

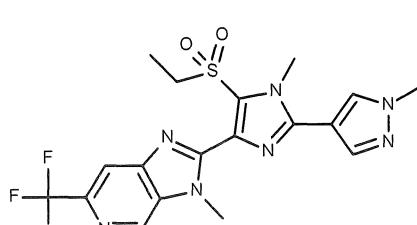
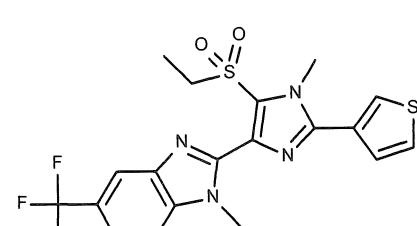
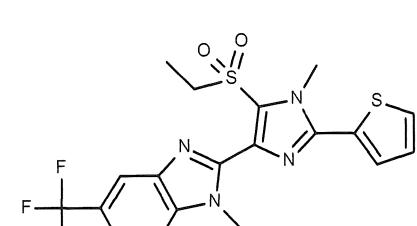
|       |   |  |
|-------|---|--|
| I-025 |    | I-025: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2070 (4,2); 8,2330 (4,4); 7,7295 (2,8); 7,7082 (5,9); 7,6702 (5,9); 7,6488 (2,8); 5,0806 (0,6); 5,0634 (0,9); 5,0463 (0,6); 3,9660 (16,0); 3,8228 (1,0); 3,8044 (3,2); 3,7859 (3,4); 3,7679 (1,0); 3,3202 (18,7); 2,6745 (0,5); 2,6705 (0,7); 2,6662 (0,5); 2,5236 (1,7); 2,5057 (91,3); 2,5014 (120,6); 2,4970 (87,3); 2,3323 (0,5); 2,3282 (0,7); 1,4632 (10,5); 1,4458 (10,4); 1,3443 (3,6); 1,3258 (8,0); 1,3073 (3,5); 0,0078 (0,4); -0,0003 (11,2)  |
| I-026 |   | I-026: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2363 (4,1); 8,4377 (2,8); 8,4312 (2,9); 8,3161 (0,4); 8,2655 (4,3); 8,0148 (3,1); 8,0112 (3,1); 6,6939 (1,9); 6,6888 (2,6); 6,6834 (1,9); 4,2368 (0,5); 4,0875 (0,7); 4,0182 (15,2); 4,0085 (16,0); 3,9949 (1,2); 3,9721 (0,8); 3,9664 (1,0); 3,9127 (0,8); 3,8297 (1,1); 3,8112 (3,4); 3,7929 (3,4); 3,7742 (1,1); 3,7595 (0,4); 3,7406 (0,4); 3,3200 (16,8); 2,6706 (2,3); 2,5428 (0,4); 2,5236 (5,7); 2,5058 (324,6); 2,5016 (416,9); 2,4972 (303,3); 2,4249 (0,5); 2,3934 (0,4); 2,3284 (2,5); 2,1167 (0,5); 2,0857 (10,0); 1,3505 (0,6); 1,3349 (3,8); 1,3163 (8,0); 1,2979 (4,1); 1,2800 (0,8); 1,2653 (0,6); 1,2487 (0,6); 1,2351 (1,2); 1,1916 (0,3); 1,1403 (0,9); 0,1461 (0,5); 0,0078 (3,7); -0,0002 (98,3); -0,1499 (0,5) |
| I-027 |  | I-027: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 20,0019 (0,4); 9,2395 (3,8); 8,7231 (5,0); 8,3154 (0,7); 8,2673 (3,9); 8,1817 (0,5); 8,1731 (5,0); 4,0701 (0,4); 4,0120 (15,3); 3,9865 (14,6); 3,9196 (0,5); 3,8513 (1,0); 3,8339 (3,2); 3,8152 (3,2); 3,7968 (1,0); 3,5229 (0,8); 3,3980 (0,5); 3,3770 (0,7); 3,3210 (242,0); 3,2523 (0,6); 3,2310 (0,5); 2,7964 (0,4); 2,6748 (3,9); 2,6703 (5,4); 2,6662 (4,0); 2,6312 (0,5); 2,5949 (0,4); 2,5238 (14,0); 2,5102 (351,9); 2,5060 (728,1); 2,5015 (968,4); 2,4970 (699,6); 2,4928 (339,6); 2,4342 (0,9); 2,3847 (0,6); 2,3328 (4,0); 2,3282 (5,5); 2,3236 (4,0); 2,1174 (0,4); 2,0856 (16,0); 1,7529 (0,5); 1,6998 (0,4); 1,4624 (0,4); 1,4049 (0,5); 1,3513 (0,8); 1,3381   |

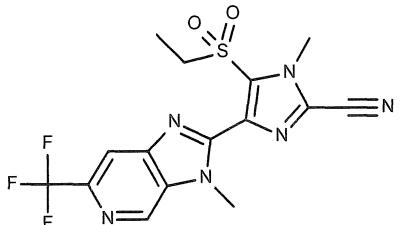
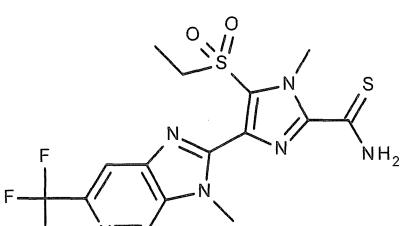
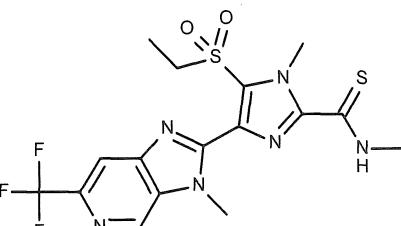
|       |   |  |
|-------|---|--|
|       |   | (3,5); 1,3195 (7,8); 1,3004 (3,6); 1,2750 (0,7); 1,2342 (1,9); 1,1921 (0,6); 1,1397 (0,9); 0,1454 (1,1); 0,0079 (9,1); -0,0002 (265,4); -0,0085 (9,6); -0,1498 (1,4)   |
| I-028 |    | I-028: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2314 (3,8); 8,2621 (4,4); 8,2403 (3,1); 8,2380 (3,6); 7,7810 (3,0); 7,7777 (3,7); 7,7744 (2,0); 7,2371 (3,0); 7,2349 (3,2); 5,7629 (1,7); 5,7554 (6,8); 4,0234 (16,0); 3,9943 (0,4); 3,8640 (1,2); 3,8456 (3,5); 3,8270 (3,8); 3,8063 (5,8); 3,7990 (15,0); 3,3238 (15,2); 2,5068 (39,7); 2,5023 (43,4); 2,4978 (28,1); 2,4933 (12,1); 1,3683 (3,9); 1,3554 (3,0); 1,3498 (8,2); 1,3313 (3,5); 0,0074 (7,2); 0,0052 (6,3); -0,0002 (28,0); -0,0085 (1,0)   |
| I-029 |   | I-029: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2122 (3,9); 8,3152 (3,0); 8,2308 (3,8); 3,9933 (15,9); 3,9653 (14,1); 3,8275 (1,0); 3,8090 (3,5); 3,7905 (3,5); 3,7721 (1,1); 3,3248 (12,4); 2,5077 (36,0); 2,5034 (47,2); 2,4990 (34,2); 2,0865 (16,0); 1,2847 (3,7); 1,2663 (8,2); 1,2478 (3,7); -0,0002 (7,7)   |
| I-030 |  | I-030: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,6875 (0,7); 9,5184 (0,6); 9,2413 (4,2); 9,2199 (0,6); 9,2109 (1,7); 9,0759 (0,4); 8,3127 (1,4); 8,2655 (4,3); 8,2452 (0,6); 8,2283 (1,8); 8,1870 (1,0); 8,1777 (1,0); 7,3929 (0,5); 5,7573 (8,2); 4,0768 (14,4); 4,0251 (16,0); 3,9938 (6,8); 3,9648 (6,0); 3,9589 (2,7); 3,9226 (2,0); 3,8593 (1,0); 3,8408 (3,4); 3,8223 (3,6); 3,8101 (1,8); 3,8041 (1,3); 3,7917 (1,6); 3,7732 (0,5); 3,7483 (0,5); 3,7299 (0,5); 3,3231 (11,2); 2,6716 (0,5); 2,6669 (0,4); 2,5244 (1,2); 2,5067 (66,2); 2,5024 (88,1); 2,4981 (64,6); 2,3335 (0,4); 2,3293 (0,5); 2,3248 (0,4); 1,3563 (3,6); 1,3380 (8,0); 1,3195 (3,6); 1,2849 (1,7); 1,2717 (1,4); 1,2665 (3,6); 1,2480 (1,6); 0,1459 (0,4); 0,0078 (2,9); -0,0002 (89,1); -0,0083 (3,9); -0,1499 (0,4) |

|       |  |   |
|-------|--|---|
| I-031 |  | I-031: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2281 (4,1); 8,2491 (4,3); 7,5783 (7,1); 7,5421 (0,4); 7,5276 (0,5); 7,5098 (0,4); 7,4641 (0,4); 7,4443 (0,4); 5,7573 (12,5); 4,0204 (16,0); 3,8913 (15,4); 3,8747 (3,5); 3,8562 (3,5); 3,8378 (1,1); 3,3223 (4,5); 2,5247 (0,6); 2,5068 (34,4); 2,5024 (45,8); 2,4980 (33,3); 2,0863 (1,3); 2,0752 (2,1); 1,3424 (3,6); 1,3240 (8,1); 1,3055 (3,6); 0,0079 (1,8); -0,0002 (54,3); -0,0084 (2,3)   |
| I-032 |  | I-032: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2254 (3,6); 8,2406 (3,8); 7,0932 (1,5); 7,0883 (2,2); 7,0830 (1,6); 6,6896 (1,7); 6,6855 (1,8); 6,6801 (1,9); 6,6759 (1,8); 6,2483 (1,8); 6,2416 (1,9); 6,2389 (2,0); 6,2321 (1,7); 4,0167 (15,2); 3,9799 (14,2); 3,8292 (1,0); 3,8106 (3,4); 3,8001 (16,0); 3,7924 (3,8); 3,7738 (1,0); 3,3230 (5,2); 2,5245 (0,5); 2,5108 (13,1); 2,5067 (27,3); 2,5023 (36,5); 2,4978 (26,3); 2,4936 (12,6); 1,3348 (3,4); 1,3164 (7,7); 1,2980 (3,4); 0,0079 (1,4); -0,0002 (42,2); -0,0085 (1,5)   |
| I-033 |  | I-033: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2227 (4,0); 8,6379 (0,3); 8,2503 (4,3); 7,9218 (3,6); 7,9184 (3,7); 7,8107 (4,0); 7,8072 (3,8); 7,6455 (0,6); 7,6271 (1,3); 7,6148 (1,0); 7,5972 (1,3); 7,5743 (1,0); 7,5665 (1,2); 7,5568 (0,9); 7,5484 (1,1); 7,5216 (0,9); 7,5068 (0,8); 7,4854 (0,4); 7,4671 (0,5); 7,4488 (0,5); 7,3670 (0,4); 7,3529 (0,8); 7,3446 (0,8); 7,3352 (0,6); 7,1911 (0,4); 5,7567 (0,6); 4,2455 (0,5); 4,1139 (14,7); 4,0577 (0,6); 3,9927 (0,8); 3,9742 (16,0); 3,9221 (0,9); 3,7733 (1,0); 3,7549 (3,4); 3,7364 (3,4); 3,7180 (1,1); 3,5505 (0,8); 3,4237 (0,4); 3,3924 (0,5); 3,3233 (104,7); 2,6751 (0,7); 2,6707 (0,9); 2,6664 (0,6); 2,5240 (2,0); 2,5061 (108,3); 2,5017 (141,4); 2,4973 (100,9); 2,3286 (0,9); 2,3239 (0,7); 1,3258 (0,4); 1,3126 (3,8); 1,2942 (8,3); 1,2757 (3,6); 1,2658 (0,5); 0,8556 (0,5); 0,1461 (0,7); 0,0079 (5,8); -0,0002 (161,5); -0,0085 (6,3); -0,1497 (0,7) |

|       |  |  |
|-------|--|--|
| I-034 |  | I-034: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 13,4858 (0,5); 9,2179 (3,6); 8,2390 (3,8); 4,0307 (12,5); 3,9799 (13,2); 3,7469 (0,8); 3,7284 (2,8); 3,7099 (2,8); 3,6914 (0,9); 3,3235 (8,0); 2,5064 (37,4); 2,5021 (48,4); 2,4978 (35,0); 2,0860 (16,0); 1,3008 (3,1); 1,2824 (6,8); 1,2639 (3,0); 0,0077 (1,8); -0,0002 (48,2); -0,0084 (1,9)   |
| I-035 |  | I-035: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,1664 (3,9); 8,2168 (4,1); 4,1840 (16,0); 4,0749 (14,9); 3,9201 (15,5); 3,7166 (0,3); 3,3536 (0,7); 3,3199 (84,5); 3,2819 (0,4); 3,0673 (1,3); 3,0487 (3,9); 3,0303 (4,0); 3,0118 (1,3); 2,8035 (0,3); 2,6748 (1,5); 2,6704 (2,1); 2,5057 (285,4); 2,5014 (371,4); 2,4971 (270,5); 2,4591 (1,3); 2,4557 (1,3); 2,3282 (2,1); 1,3976 (0,9); 1,3713 (0,6); 1,1151 (4,3); 1,0967 (9,0); 1,0783 (4,1); 0,1463 (1,6); 0,0345 (2,4); 0,0077 (16,0); -0,0003 (351,8); -0,0371 (1,0); -0,1495 (1,7) |
| I-036 |  | I-036: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2249 (4,0); 8,2560 (4,2); 4,2425 (13,6); 4,1919 (0,7); 4,1422 (0,4); 3,9939 (0,7); 3,9394 (15,9); 3,9336 (16,0); 3,8943 (0,5); 3,8390 (0,3); 3,7836 (1,0); 3,7656 (3,2); 3,7470 (3,3); 3,7270 (1,4); 3,3194 (47,5); 2,6702 (1,4); 2,5012 (244,8); 2,4971 (186,1); 2,3273 (1,4); 2,0857 (1,7); 1,3976 (2,7); 1,3041 (0,5); 1,2883 (3,4); 1,2702 (7,3); 1,2516 (3,4); 0,1459 (0,5); -0,0001 (118,8); -0,1504 (0,5)   |
| I-037 |  | I-037: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,5733 (0,5); 9,5569 (1,1); 9,5409 (0,6); 9,2497 (4,0); 8,2645 (4,2); 5,7564 (10,5); 4,2847 (15,0); 4,1156 (0,3); 4,0934 (1,1); 4,0765 (1,2); 4,0699 (1,2); 4,0533 (1,1); 4,0298 (0,4); 3,9776 (16,0); 3,7524 (1,0); 3,7339 (3,4); 3,7154 (3,4); 3,6971 (1,0); 3,3254 (4,2); 2,5249 (0,4); 2,5111 (10,7); 2,5068 (22,5); 2,5024 (30,2); 2,4979 (21,7); 2,4936 (10,4); 1,2805 (3,7); 1,2621 (8,3); 1,2437 (3,7); 0,0076 (1,2); -0,0002 (35,2); -0,0084 (1,3)                                  |

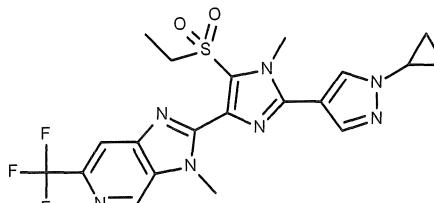
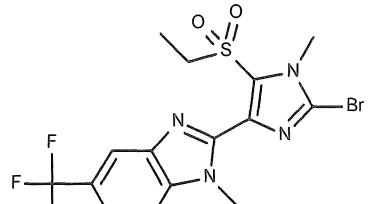
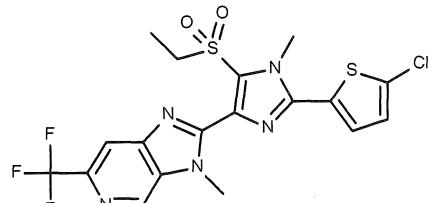
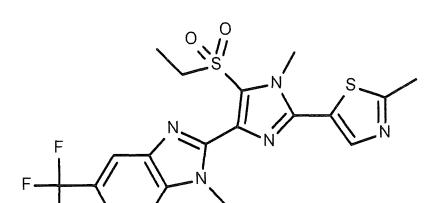
|       |   |  |
|-------|---|--|
| I-038 |    | I-038: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2407 (4,1); 8,3256 (1,6); 8,2524 (4,5); 8,0175 (1,6); 4,2789 (14,8); 4,1913 (0,3); 4,1155 (0,4); 3,9779 (16,0); 3,9413 (0,6); 3,7748 (1,1); 3,7564 (3,4); 3,7380 (3,5); 3,7194 (1,1); 3,3211 (261,3); 2,6748 (1,8); 2,6707 (2,5); 2,6662 (1,8); 2,5236 (5,8); 2,5059 (331,0); 2,5016 (435,6); 2,4972 (312,5); 2,4367 (0,4); 2,3323 (1,8); 2,3280 (2,4); 1,2831 (3,8); 1,2646 (8,3); 1,2463 (3,8); 0,1464 (1,0); 0,0078 (7,8); -0,0001 (217,9); -0,0078 (8,1); -0,1494 (1,0)  |
| I-039 |   | I-039: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2441 (4,2); 8,9444 (1,0); 8,9323 (1,0); 8,2560 (4,4); 5,7571 (7,8); 4,2855 (15,1); 4,2116 (0,4); 3,9729 (16,0); 3,7629 (1,0); 3,7445 (3,5); 3,7260 (3,6); 3,7076 (1,1); 3,6176 (0,5); 3,6013 (1,1); 3,5851 (0,5); 3,5093 (0,4); 3,3222 (7,5); 2,8314 (0,4); 2,8227 (0,4); 2,8063 (7,2); 2,7944 (7,1); 2,5936 (0,4); 2,5817 (0,3); 2,5509 (0,5); 2,5393 (0,6); 2,5064 (37,6); 2,5021 (49,7); 2,4978 (36,4); 2,3288 (0,3); 2,1838 (0,4); 2,1488 (0,4); 1,7760 (0,5); 1,7679 (0,5); 1,7597 (1,3); 1,7514 (0,5); 1,7435 (0,4); 1,3560 (2,2); 1,2788 (3,8); 1,2604 (8,4); 1,2419 (4,0); 0,0078 (1,1); -0,0002 (28,4); -0,0080 (1,2) |
| I-040 |  | I-040: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2261 (4,2); 8,2465 (4,4); 5,7569 (10,2); 4,1935 (0,3); 4,0142 (0,4); 3,9843 (16,0); 3,9720 (15,3); 3,8568 (1,2); 3,8492 (0,9); 3,8385 (3,5); 3,8200 (3,5); 3,8018 (1,2); 3,7273 (0,4); 3,6015 (0,8); 3,5850 (0,3); 3,3209 (6,8); 3,1305 (15,8); 3,0751 (14,6); 3,0327 (0,6); 3,0178 (0,4); 2,6709 (0,5); 2,5365 (1,9); 2,5061 (63,2); 2,5019 (78,1); 2,4977 (59,4); 2,3289 (0,4); 1,7687 (0,4); 1,7600 (0,8); 1,3557 (1,4); 1,3112 (3,8); 1,2928 (8,0); 1,2743 (3,8); 1,2367 (0,5); -0,0002 (45,9)   |
| I-041 |  | I-041: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2428 (4,4); 9,0191 (0,7); 9,0050 (1,4); 8,9904 (0,7); 8,2570 (4,7); 5,7576 (5,8); 4,2823 (15,2); 4,2189 (0,4); 4,1661 (0,3); 4,0776 (0,3); 3,9645 (16,0); 3,7411 (1,1); 3,7225 (3,6); 3,7040 (3,6); 3,6857   |

|       |   |  |
|-------|---|--|
|       |   | (1,2); 3,6175 (0,7); 3,6013 (1,6); 3,5859 (0,7); 3,3331 (0,8); 3,3212 (9,0); 3,2990 (2,7); 3,2822 (2,1); 3,2648 (0,7); 2,6711 (0,4); 2,5062 (48,1); 2,5021 (62,8); 2,4980 (46,6); 2,3288 (0,4); 1,7761 (0,7); 1,7682 (0,8); 1,7600 (1,8); 1,7517 (0,8); 1,7441 (0,6); 1,3559 (0,6); 1,2718 (3,9); 1,2534 (8,3); 1,2350 (3,9); 1,1410 (4,1); 1,1231 (8,7); 1,1052 (4,1); 0,0075 (1,3); -0,0001 (35,0)   |
| I-042 |    | I-042: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2163 (3,9); 8,4144 (4,4); 8,2368 (4,2); 8,0115 (4,9); 5,7565 (5,5); 4,0199 (14,6); 3,9770 (16,0); 3,9556 (15,4); 3,7510 (0,9); 3,7326 (3,3); 3,7141 (3,3); 3,6957 (1,0); 3,3228 (38,5); 2,6709 (0,4); 2,5242 (1,0); 2,5107 (27,7); 2,5064 (57,6); 2,5019 (76,7); 2,4974 (54,2); 2,4931 (25,3); 2,3286 (0,4); 1,3004 (3,7); 1,2820 (8,2); 1,2635 (3,5); 0,1461 (0,3); 0,0078 (2,6); -0,0002 (75,8); -0,0086 (2,7); -0,1497 (0,3)  |
| I-043 |  | I-043: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2235 (4,2); 8,2469 (4,4); 8,2292 (2,1); 8,2261 (2,3); 8,2221 (2,4); 8,2190 (2,2); 7,8163 (1,8); 7,8090 (1,8); 7,8037 (2,1); 7,7964 (2,0); 7,6257 (2,5); 7,6228 (2,4); 7,6132 (2,2); 7,6101 (2,1); 5,7569 (6,0); 4,0469 (15,1); 3,9943 (16,0); 3,9811 (0,5); 3,7964 (1,0); 3,7779 (3,4); 3,7594 (3,5); 3,7411 (1,1); 3,3241 (17,8); 2,5245 (0,6); 2,5067 (35,8); 2,5024 (46,5); 2,4980 (33,6); 1,3232 (3,7); 1,3047 (8,2); 1,2863 (3,6); 0,0080 (1,5); 0,0000 (41,4); -0,0083 (1,7) |
| I-044 |  | I-044: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2224 (4,1); 8,2491 (4,3); 7,8941 (2,1); 7,8830 (2,2); 7,7993 (2,0); 7,7975 (2,0); 7,7900 (2,2); 7,3258 (1,8); 7,3163 (1,9); 7,3133 (1,9); 7,3038 (1,7); 5,7568 (14,3); 4,1123 (14,8); 3,9812 (16,0); 3,7713 (1,0); 3,7529 (3,4); 3,7344 (3,5); 3,7160 (1,0); 3,3249 (7,3); 2,5248 (0,6); 2,5071 (28,6); 2,5027 (38,1); 2,4983 (27,5); 1,3148 (3,7); 1,2964 (8,2); 1,2779 (3,6); 0,0077 (1,5); -0,0002 (39,0); -0,0084 (1,5)  |

|       |   |   |
|-------|---|---|
| I-045 |    | I-045: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,1998 (0,5); 9,2474 (3,8); 8,2746 (4,0); 5,7566 (1,2); 4,3215 (0,6); 4,2387 (0,6); 4,1254 (0,6); 4,0878 (14,5); 3,9946 (16,0); 3,9634 (0,4); 3,9277 (0,5); 3,8915 (1,0); 3,8728 (3,4); 3,8543 (3,4); 3,8358 (1,0); 3,3196 (32,3); 2,6750 (0,6); 2,6705 (0,8); 2,6659 (0,6); 2,5238 (1,8); 2,5101 (49,3); 2,5059 (104,6); 2,5015 (141,8); 2,4970 (102,3); 2,4927 (49,2); 2,3327 (0,6); 2,3283 (0,8); 2,3238 (0,6); 1,3511 (1,0); 1,3425 (0,4); 1,3228 (3,9); 1,3043 (8,0); 1,2858 (3,6); 1,2652 (0,4); 1,2601 (0,5); 1,2332 (1,4); 0,1457 (0,5); 0,0079 (3,3); -0,0002 (111,7); -0,0084 (4,4); -0,1497 (0,5) |
| I-046 |   | I-046: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,6016 (0,9); 10,1030 (0,9); 9,2297 (4,0); 8,3154 (0,4); 8,2500 (4,3); 4,1417 (15,0); 3,9941 (16,0); 3,8340 (1,0); 3,8154 (3,4); 3,7969 (3,5); 3,7780 (1,1); 3,3630 (0,5); 3,3229 (172,6); 2,6750 (2,3); 2,6705 (3,0); 2,6663 (2,2); 2,5235 (7,5); 2,5101 (197,8); 2,5058 (410,0); 2,5014 (548,3); 2,4970 (393,8); 2,4928 (189,2); 2,3326 (2,3); 2,3282 (3,0); 2,3237 (2,2); 1,3047 (3,6); 1,2864 (8,1); 1,2679 (3,5); 0,1464 (1,0); 0,0078 (8,2); -0,0002 (231,4); -0,0083 (9,0); -0,1497 (1,1)   |
| I-047 |  | I-047: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 11,0260 (0,9); 11,0143 (0,8); 9,2316 (4,0); 8,3158 (0,5); 8,2542 (4,4); 4,1062 (14,9); 3,9927 (16,0); 3,8284 (1,0); 3,8099 (3,6); 3,7911 (4,0); 3,7733 (2,0); 3,4128 (0,3); 3,3308 (102,0); 3,2859 (0,6); 3,1744 (7,0); 3,1624 (6,9); 2,6749 (2,7); 2,6704 (3,6); 2,6656 (2,8); 2,5407 (1,4); 2,5363 (1,2); 2,5235 (8,9); 2,5057 (490,1); 2,5013 (643,6); 2,4969 (460,1); 2,4525 (1,0); 2,4437 (0,8); 2,3285 (3,6); 2,3235 (2,7); 1,3032 (3,5); 1,2847 (8,1); 1,2662 (3,6); 0,1459 (1,3); 0,0078 (9,9); -0,0003 (266,2); -0,0081 (11,0); -0,0379 (0,4); -0,1494 (1,3)   |

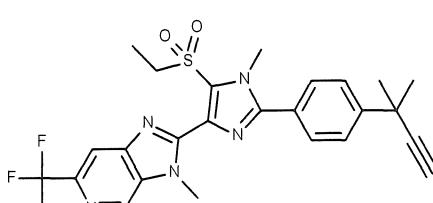
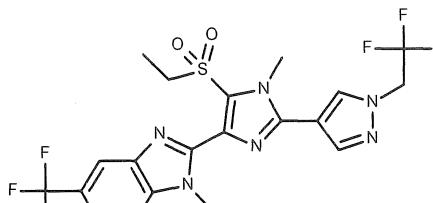
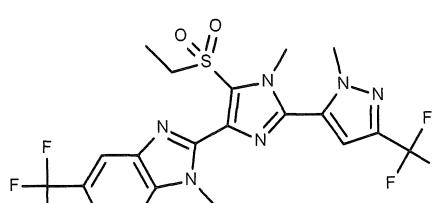
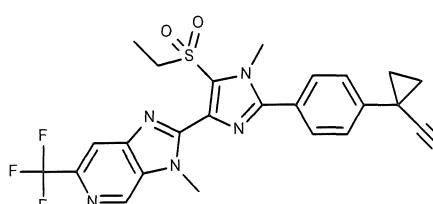
|       |  |   |
|-------|--|---|
| I-048 |  | I-048: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2235 (4,2); 8,2438 (4,5); 8,1331 (0,3); 5,7553 (6,6); 4,1921 (0,4); 3,9849 (16,0); 3,8890 (15,0); 3,8681 (1,1); 3,8496 (3,4); 3,8312 (3,4); 3,8129 (1,0); 3,7263 (0,4); 3,5463 (14,5); 3,3213 (30,4); 3,2712 (15,2); 2,6704 (0,5); 2,5232 (1,1); 2,5055 (67,5); 2,5012 (90,0); 2,4969 (65,2); 2,3279 (0,5); 2,3242 (0,4); 1,3104 (3,7); 1,2920 (8,1); 1,2736 (3,6); 0,0070 (2,4); -0,0007 (64,8); -0,0085 (2,8)   |
| I-049 |  | I-049: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2258 (3,8); 8,2475 (4,1); 8,1372 (1,0); 7,9785 (3,2); 7,9726 (3,3); 6,8941 (3,7); 6,8883 (3,7); 4,2964 (14,0); 3,9797 (16,0); 3,7548 (1,0); 3,7364 (3,3); 3,7179 (3,4); 3,6994 (1,0); 2,5426 (2,2); 2,5257 (0,6); 2,5208 (0,9); 2,5121 (16,1); 2,5077 (34,6); 2,5033 (47,1); 2,4987 (33,8); 2,4943 (16,0); 2,0865 (7,7); 1,2958 (3,6); 1,2775 (8,1); 1,2590 (3,5); 0,0080 (0,5); -0,0002 (17,2); -0,0084 (0,6)  |
| I-050 |  | I-050: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2107 (4,1); 8,2314 (4,3); 7,6281 (0,4); 7,5991 (0,3); 5,7574 (8,2); 4,0144 (16,0); 3,8650 (1,0); 3,8466 (3,3); 3,8281 (3,4); 3,8097 (1,0); 3,7642 (15,4); 3,7571 (15,0); 3,3251 (16,3); 2,5421 (0,5); 2,5248 (0,4); 2,5113 (11,9); 2,5072 (24,8); 2,5027 (33,2); 2,4983 (24,0); 2,4941 (11,5); 2,2586 (15,4); 2,1401 (15,7); 1,3247 (3,6); 1,3063 (8,1); 1,2878 (3,6); -0,0002 (8,6); -0,0085 (0,3)   |
| I-051 |  | I-051: $^1\text{H-NMR}$ (601,6 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,3583 (4,9); 9,2205 (3,4); 8,5626 (4,9); 8,2440 (3,6); 5,7506 (2,1); 4,1175 (15,2); 3,9780 (16,0); 3,9571 (1,3); 3,9232 (1,2); 3,7701 (0,9); 3,7579 (3,3); 3,7456 (3,3); 3,7334 (1,1); 3,3050 (49,6); 2,6125 (0,5); 2,5216 (0,8); 2,5186 (1,0); 2,5155 (0,9); 2,5067 (26,9); 2,5036 (59,9); 2,5006 (85,5); 2,4976 (61,4); 2,4945 (28,7); 2,3849 (0,5); 1,3153 (3,5); 1,3030 (7,9); 1,2907 (3,5); 1,2722 (0,7); 1,2598 (0,4); 0,0053 (2,0); -0,0002 (76,1); -0,0057 (2,5) |

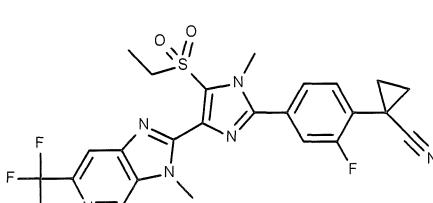
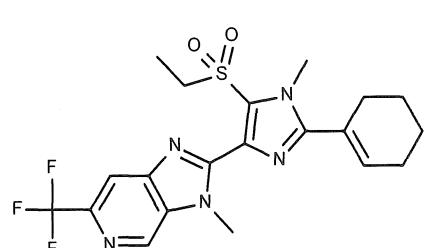
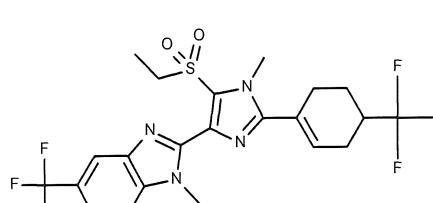


|       |   |   |
|-------|---|---|
| I-055 |    | I-055: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2167 (4,3); 8,4783 (5,2); 8,2349 (4,7); 8,0020 (5,1); 5,7551 (11,1); 4,0229 (15,0); 3,9744 (16,0); 3,8973 (0,4); 3,8877 (0,8); 3,8786 (1,1); 3,8695 (1,6); 3,8600 (1,2); 3,8510 (0,8); 3,8414 (0,5); 3,7484 (1,1); 3,7299 (3,6); 3,7115 (3,6); 3,6931 (1,1); 3,3221 (22,9); 2,5069 (21,6); 2,5027 (27,1); 2,4985 (19,5); 1,2986 (3,9); 1,2802 (8,5); 1,2618 (3,8); 1,1703 (0,6); 1,1565 (1,8); 1,1490 (3,0); 1,1407 (2,9); 1,1301 (1,0); 1,1005 (0,5); 1,0618 (1,0); 1,0496 (2,1); 1,0436 (2,5); 1,0311 (2,5); 1,0123 (0,6); 0,0078 (1,5); -0,0002 (28,4) |
| I-056 |   | I-056: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,7026 (5,5); 4,0569 (16,0); 3,9410 (14,5); 3,7958 (1,0); 3,7773 (3,4); 3,7588 (3,5); 3,7404 (1,0); 3,3226 (25,5); 2,5258 (0,4); 2,5123 (9,1); 2,5080 (18,3); 2,5035 (24,1); 2,4989 (17,4); 2,4945 (8,5); 1,3059 (3,6); 1,2970 (0,4); 1,2875 (8,1); 1,2690 (3,6); 0,0078 (0,8); -0,0002 (22,4); -0,0084 (0,9)   |
| I-057 |  | I-057: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2205 (4,1); 8,2441 (4,5); 7,6744 (3,2); 7,6642 (3,4); 7,3604 (3,4); 7,3502 (3,2); 5,7563 (7,8); 4,1016 (14,6); 4,0341 (0,8); 3,9957 (1,0); 3,9748 (16,0); 3,7732 (1,0); 3,7549 (3,5); 3,7364 (3,5); 3,7179 (1,1); 3,3239 (17,9); 2,5250 (0,4); 2,5115 (9,2); 2,5074 (18,4); 2,5030 (24,3); 2,4985 (17,9); 2,4942 (9,0); 1,3134 (3,8); 1,3061 (1,0); 1,2951 (8,3); 1,2766 (3,7); 0,0077 (1,0); -0,0002 (26,4); -0,0084 (1,2)   |
| I-058 |  | I-058: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2192 (4,1); 8,2804 (6,2); 8,2463 (4,4); 5,7561 (0,5); 4,0957 (15,0); 3,9736 (16,0); 3,7800 (1,0); 3,7615 (3,5); 3,7431 (3,5); 3,7247 (1,1); 3,3221 (24,2); 2,7517 (15,7); 2,5246 (0,6); 2,5068 (28,1); 2,5024 (36,2); 2,4979 (26,1); 1,3170 (3,8); 1,2986 (8,4); 1,2801 (3,7); 1,2342 (1,4); 0,0079 (1,1); -0,0002 (32,8); -0,0083 (1,3)  |

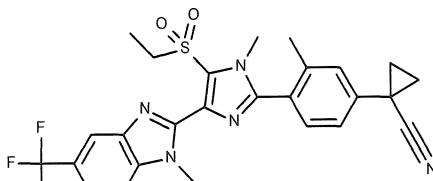
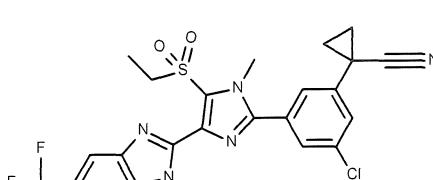
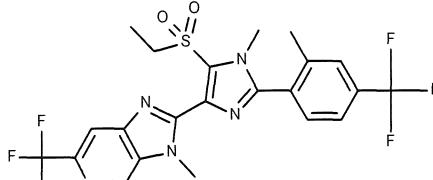
|       |  |  |
|-------|--|--|
| I-059 |  | I-059: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2335 (3,6); 8,2483 (3,8); 7,5894 (5,8); 5,7559 (4,9); 4,0131 (14,5); 3,9948 (13,4); 3,8403 (0,9); 3,8218 (3,1); 3,8033 (3,2); 3,7848 (1,0); 3,7619 (16,0); 3,3221 (44,8); 2,5064 (38,8); 2,5020 (51,2); 2,4975 (37,6); 1,3404 (3,3); 1,3220 (7,4); 1,3035 (3,2); 0,0079 (2,1); -0,0002 (58,0); -0,0084 (2,8)   |
| I-060 |  | I-060: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2198 (3,2); 9,0638 (0,4); 8,2410 (3,4); 8,1023 (0,4); 7,9300 (2,5); 7,9244 (2,5); 6,8591 (2,8); 6,8535 (2,8); 6,7669 (0,4); 6,7612 (0,3); 5,7557 (16,0); 4,3379 (1,7); 4,2776 (12,0); 4,1363 (1,9); 3,9964 (12,7); 3,9701 (13,0); 3,9458 (1,8); 3,8510 (1,6); 3,7494 (0,8); 3,7309 (2,7); 3,7125 (2,8); 3,6941 (0,8); 3,3196 (55,4); 2,6746 (0,4); 2,6703 (0,5); 2,6660 (0,4); 2,5234 (1,3); 2,5100 (30,5); 2,5058 (61,3); 2,5013 (80,5); 2,4968 (58,2); 2,4924 (28,5); 2,3327 (0,4); 2,3280 (0,5); 2,3235 (0,4); 1,2890 (3,0); 1,2706 (6,7); 1,2521 (2,9); 1,2348 (0,7); 0,1456 (0,4); 0,0075 (2,8); -0,0002 (81,9); -0,0085 (3,3); -0,1501 (0,4) |
| I-061 |  | I-061: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2196 (4,1); 8,2412 (4,4); 7,9304 (3,0); 7,9247 (3,1); 7,6460 (0,4); 7,6279 (0,8); 7,6160 (0,6); 7,5988 (0,6); 7,5746 (0,4); 7,5669 (0,5); 7,5576 (0,4); 7,5505 (0,5); 6,8646 (3,4); 6,8589 (3,4); 5,7562 (5,6); 4,2717 (14,8); 4,0247 (0,4); 4,0181 (0,3); 4,0077 (1,4); 3,9969 (16,0); 3,9736 (1,4); 3,9468 (15,9); 3,8000 (0,7); 3,3228 (34,1); 2,5249 (0,7); 2,5070 (32,4); 2,5026 (42,0); 2,4982 (30,4); 1,3050 (2,1); 1,2939 (13,8); 1,2768 (13,5); 0,0076 (1,6); -0,0002 (39,5); -0,0085 (1,5)   |
| I-062 |  | I-062: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2364 (3,6); 8,2523 (3,9); 7,6837 (3,1); 7,6788 (3,2); 6,9157 (3,1); 6,9106 (3,2); 5,7558 (9,5); 4,0287 (14,3); 4,0168 (16,0); 3,9741 (13,1); 3,9587 (0,6); 3,9229 (0,4); 3,8583 (0,9); 3,8398 (3,1); 3,8214 (3,1); 3,8029 (1,0); 3,3208 (25,7); 2,6709 (0,3); 2,5241 (0,9); 2,5063 (43,7); 2,5020 (57,1); 2,4976 (41,8); 2,3289  |

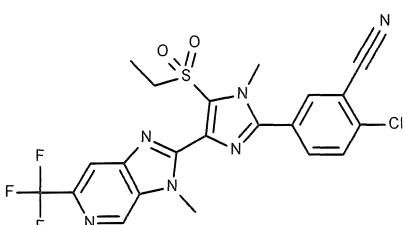
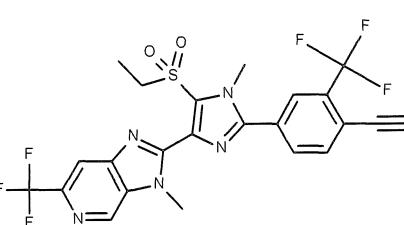
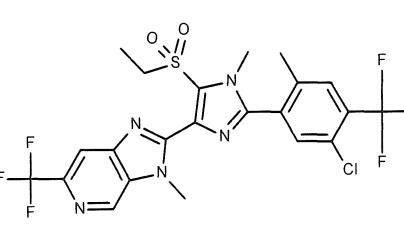
|       |  |  |
|-------|--|--|
|       |  | (0,3); 1,3502 (3,3); 1,3318 (7,2); 1,3133 (3,2); 0,0077 (2,4); -0,0002 (59,3); -0,0082 (2,6)   |
| I-063 |  | I-063: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,7040 (5,7); 7,8826 (4,4); 7,8616 (5,1); 7,7027 (5,4); 7,6817 (4,0); 4,1104 (16,0); 4,0561 (0,7); 4,0384 (2,0); 4,0206 (2,1); 4,0026 (1,3); 3,9801 (14,8); 3,8544 (1,4); 3,8359 (3,8); 3,8174 (3,7); 3,7989 (1,2); 3,3251 (34,7); 3,3214 (59,4); 2,6751 (0,5); 2,6712 (0,6); 2,5063 (88,3); 2,5022 (97,5); 2,3330 (0,5); 2,3291 (0,6); 1,9890 (7,0); 1,3977 (5,8); 1,3566 (4,3); 1,3381 (8,4); 1,3197 (3,8); 1,1928 (2,0); 1,1791 (1,8); 1,1751 (3,8); 1,1572 (1,8); 0,1463 (0,3); 0,0038 (36,1); -0,0002 (73,7); -0,1495 (0,4)                                     |
| I-064 |  | I-064: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2085 (0,3); 9,1926 (3,9); 8,3148 (0,4); 8,3082 (0,3); 8,2250 (0,4); 8,2111 (4,1); 7,5210 (0,4); 3,9924 (1,1); 3,9635 (1,1); 3,9502 (16,0); 3,8537 (14,3); 3,7152 (1,0); 3,6966 (3,4); 3,6782 (3,5); 3,6597 (1,1); 3,3197 (229,5); 2,6748 (1,4); 2,6704 (2,0); 2,6658 (1,6); 2,5235 (4,6); 2,5057 (258,4); 2,5013 (339,1); 2,4969 (251,2); 2,3324 (1,4); 2,3279 (2,0); 2,3238 (1,6); 1,3978 (12,9); 1,2841 (0,3); 1,2730 (3,7); 1,2654 (1,0); 1,2546 (8,0); 1,2361 (3,7); 1,1399 (0,4); 0,1457 (1,5); 0,0077 (10,8); -0,0004 (318,3); -0,0081 (14,8); -0,1497 (1,5) |
| I-065 |  | I-065: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2229 (4,0); 8,2479 (4,3); 7,8698 (3,8); 7,8493 (4,5); 7,5941 (3,8); 7,5736 (3,3); 4,1902 (7,9); 4,0118 (16,0); 3,9708 (14,6); 3,8306 (1,1); 3,8121 (3,4); 3,7935 (3,4); 3,7751 (1,0); 3,3236 (123,7); 2,6755 (0,4); 2,6709 (0,5); 2,6662 (0,4); 2,5243 (1,2); 2,5107 (33,2); 2,5064 (69,1); 2,5020 (92,6); 2,4975 (67,5); 2,4932 (33,5); 2,3332 (0,4); 2,3286 (0,6); 2,3244 (0,4); 2,0860 (1,6); 1,3977 (14,8); 1,3427 (3,7); 1,3242 (8,2); 1,3058 (3,6); 0,0078 (0,8); -0,0002 (24,6); -0,0083 (1,2)  |

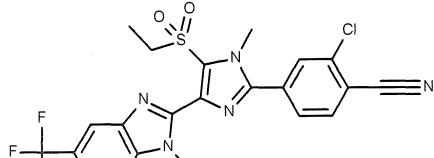
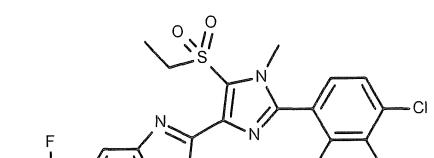
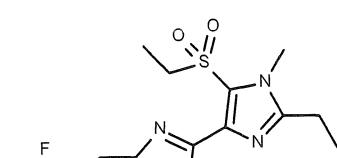
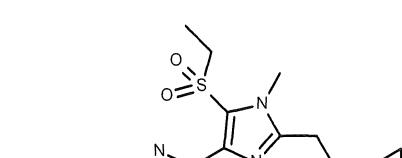
|       |   |  |
|-------|---|--|
| I-066 |    | I-066: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2230 (2,3); 8,2483 (2,5); 7,9002 (2,0); 7,8794 (2,8); 7,7640 (2,7); 7,7429 (2,1); 4,0140 (8,9); 3,9759 (8,1); 3,8459 (0,6); 3,8275 (1,9); 3,8090 (2,0); 3,7907 (0,6); 3,3224 (240,3); 2,6747 (0,8); 2,6705 (1,1); 2,6662 (0,8); 2,5059 (137,3); 2,5015 (179,7); 2,4971 (131,4); 2,3326 (0,8); 2,3283 (1,0); 2,3239 (0,8); 1,7628 (16,0); 1,6237 (0,7); 1,3977 (9,7); 1,3472 (2,1); 1,3288 (4,6); 1,3103 (2,0); -0,0002 (42,2); -0,0082 (1,9)   |
| I-067 |   | I-067: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2199 (4,1); 8,5699 (4,8); 8,2407 (4,4); 8,1849 (5,4); 5,7547 (0,6); 5,3234 (0,8); 5,3010 (2,5); 5,2784 (2,6); 5,2558 (0,9); 4,0344 (14,7); 3,9813 (16,0); 3,7511 (1,0); 3,7327 (3,4); 3,7143 (3,4); 3,6959 (1,0); 3,3920 (0,8); 3,3745 (0,8); 3,3568 (0,4); 3,3295 (111,6); 2,5248 (0,7); 2,5110 (18,7); 2,5070 (38,6); 2,5026 (51,7); 2,4982 (37,9); 2,4939 (18,8); 1,3051 (3,7); 1,2868 (8,2); 1,2683 (3,6); 1,1088 (0,8); 1,0913 (1,6); 1,0738 (0,8); 0,0077 (1,2); -0,0002 (35,8); -0,0084 (1,6) |
| I-068 |  | I-068: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2442 (4,4); 8,2582 (4,8); 7,6273 (0,5); 7,6153 (0,4); 7,5986 (0,4); 7,5664 (0,4); 7,4554 (5,0); 5,7558 (1,6); 4,1092 (14,3); 4,0336 (16,0); 4,0002 (14,9); 3,9656 (0,4); 3,8744 (1,1); 3,8559 (3,6); 3,8375 (3,6); 3,8190 (1,2); 3,3210 (22,8); 2,6712 (0,4); 2,5066 (38,8); 2,5024 (50,9); 2,4986 (38,1); 2,3291 (0,4); 1,3588 (3,8); 1,3403 (8,3); 1,3219 (3,7); 0,0078 (1,4); -0,0002 (37,7)  |
| I-069 |  | I-069: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2195 (4,1); 8,2458 (4,5); 7,8530 (3,9); 7,8322 (4,8); 7,5543 (4,6); 7,5333 (4,1); 5,7550 (5,1); 4,0061 (16,0); 3,9884 (0,4); 3,9618 (14,6); 3,8306 (1,0); 3,8122 (3,4); 3,7936 (3,5); 3,7752 (1,1); 3,3225 (225,3); 2,6748 (0,8); 2,6707 (1,1); 2,6662 (0,8); 2,5238 (2,5); 2,5101 (64,4); 2,5059 (134,6); 2,5015 (181,6); 2,4971 (132,7); 2,4927 (65,6); 2,3326 (0,7); 2,3284 (1,0); 2,3238 (0,8); 2,0860 (0,9);  |

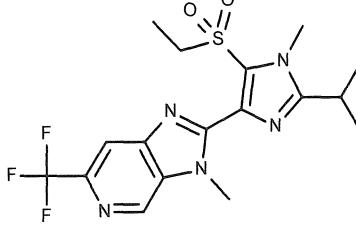
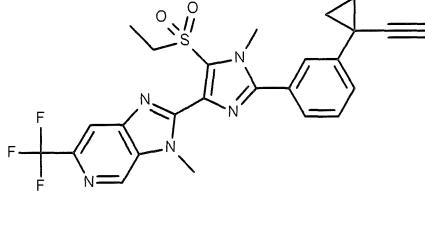
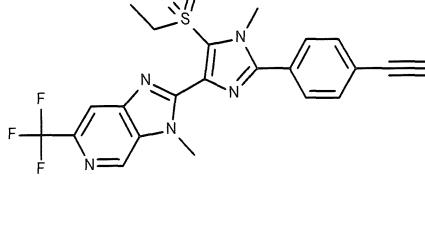
|       |   |   |
|-------|---|---|
|       |   | 1,8790 (1,1); 1,8658 (3,4); 1,8586 (3,7);<br>1,8472 (1,5); 1,6580 (1,4); 1,6457 (3,4);<br>1,6386 (3,6); 1,6250 (1,1); 1,3975 (4,8);<br>1,3406 (3,7); 1,3222 (8,3); 1,3037 (3,6);<br>0,0076 (1,4); 0,0000 (46,2); -0,0083 (2,1)  |
| I-070 |    | I-070: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta=9,2233 (4,4); 8,3139 (0,7); 8,2472 (4,7); 7,8142 (1,7); 7,7884 (1,9); 7,7140 (0,4); 7,6938 (2,2); 7,6818 (4,8); 5,7543 (0,9); 4,0106 (16,0); 3,9814 (14,8); 3,9577 (2,1); 3,9221 (1,9); 3,8467 (1,0); 3,8282 (3,5); 3,8097 (3,5); 3,7909 (1,1); 3,7469 (0,4); 3,7279 (0,4); 3,3217 (397,6); 2,6751 (1,7); 2,6707 (2,4); 2,6664 (1,8); 2,5238 (5,8); 2,5061 (302,8); 2,5017 (403,0); 2,4973 (301,5); 2,3328 (1,7); 2,3284 (2,3); 2,3240 (1,8); 1,7980 (1,2); 1,7848 (3,2); 1,7780 (3,6); 1,7663 (1,5); 1,5838 (1,5); 1,5715 (3,4); 1,5650 (3,6); 1,5514 (1,2); 1,3980 (1,9); 1,3487 (3,7); 1,3303 (8,2); 1,3118 (3,6); 1,2899 (0,6); 1,2717 (1,0); 1,2528 (0,5); 0,1459 (0,5); 0,0079 (3,5); -0,0001 (102,8); -0,1496 (0,5)$ |
| I-071 |  | I-071: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta=9,1991 (4,1); 8,2161 (4,4); 6,3045 (1,2); 6,3006 (1,6); 3,9526 (16,0); 3,9078 (14,7); 3,7554 (1,0); 3,7370 (3,4); 3,7185 (3,5); 3,7000 (1,1); 3,3227 (110,2); 2,6748 (0,4); 2,6709 (0,6); 2,5239 (1,3); 2,5062 (68,7); 2,5018 (91,9); 2,4975 (67,5); 2,4079 (1,9); 2,4026 (1,9); 2,3284 (0,6); 2,3241 (0,4); 2,2806 (1,3); 2,2742 (1,7); 2,2661 (1,8); 1,7607 (0,4); 1,7454 (0,9); 1,7333 (1,4); 1,7227 (1,5); 1,7190 (1,4); 1,7083 (0,8); 1,7029 (0,8); 1,6867 (0,8); 1,6769 (1,5); 1,6719 (1,5); 1,6627 (1,4); 1,6581 (1,4); 1,6497 (0,9); 1,3977 (13,8); 1,2873 (3,7); 1,2689 (8,1); 1,2504 (3,6); 1,0690 (0,5); 0,0080 (0,9); -0,0002 (26,5); -0,0083 (1,3)$  |
| I-072 |  | I-072: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta=9,2013 (3,9); 8,2207 (4,2); 6,3180 (1,1); 3,9518 (16,0); 3,9274 (14,7); 3,7604 (1,0); 3,7420 (3,3); 3,7235 (3,3); 3,7050 (1,0); 3,3251 (41,4); 2,7032 (0,4); 2,6954 (0,4); 2,6810 (0,4); 2,6715 (0,5); 2,6665 (0,5); 2,6608 (0,5); 2,6537 (0,5);$   |

|       |  |   |
|-------|--|---|
|       |  | 2,6001 (0,8); 2,5821 (0,5); 2,5488 (0,7);<br>2,5367 (1,1); 2,5246 (1,2); 2,5111 (14,2);<br>2,5068 (29,0); 2,5024 (38,4); 2,4979<br>(27,5); 2,4935 (13,2); 2,3511 (0,4);<br>2,3447 (0,4); 2,3336 (0,4); 2,3287 (0,5);<br>2,3246 (0,5); 2,3096 (0,4); 2,0966 (0,5);<br>2,0862 (0,6); 2,0777 (0,4); 2,0645 (0,6);<br>1,6519 (0,6); 1,6383 (0,6); 1,6221 (0,6);<br>1,6079 (0,5); 1,3975 (0,5); 1,2908 (3,7);<br>1,2724 (8,2); 1,2540 (3,6); 0,0079 (0,8); -<br>0,0002 (25,1); -0,0085 (0,9)   |
| I-073 |  | I-073: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,1991 (2,5); 8,2176 (2,6); 6,2364<br>(1,0); 6,2322 (0,8); 3,9516 (9,8); 3,9061<br>(8,9); 3,7447 (0,6); 3,7264 (2,1); 3,7079<br>(2,2); 3,6893 (0,6); 3,3190 (20,2); 2,6706<br>(0,4); 2,5238 (1,4); 2,5103 (26,7); 2,5061<br>(54,3); 2,5016 (72,4); 2,4972 (53,6);<br>2,4931 (27,4); 2,4439 (1,2); 2,4389 (1,2);<br>2,3286 (0,4); 2,0763 (1,6); 2,0677 (1,6);<br>1,5123 (1,1); 1,4966 (2,3); 1,4803 (1,1);<br>1,3979 (2,7); 1,2860 (2,2); 1,2675 (5,0);<br>1,2491 (2,2); 0,9872 (16,0); 0,0078 (1,3);<br>-0,0002 (32,4)   |
| I-074 |  | I-074: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,1987 (4,2); 8,2191 (4,5); 6,2749<br>(1,8); 3,9481 (16,0); 3,9044 (14,8);<br>3,7487 (1,2); 3,7301 (3,6); 3,7115 (3,5);<br>3,6932 (1,1); 3,3291 (47,1); 3,3223<br>(128,4); 2,6746 (0,7); 2,6706 (0,8);<br>2,5057 (125,9); 2,5014 (139,4); 2,4971<br>(96,1); 2,4083 (1,4); 2,3656 (1,1); 2,3328<br>(0,8); 2,3282 (0,8); 1,9068 (0,6); 1,8843<br>(0,7); 1,8771 (0,6); 1,8395 (1,2); 1,7976<br>(1,2); 1,7619 (0,7); 1,3953 (0,4); 1,3683<br>(0,8); 1,3542 (0,8); 1,3424 (0,7); 1,3376<br>(0,8); 1,3233 (0,7); 1,3110 (0,6); 1,2835<br>(4,0); 1,2651 (8,2); 1,2466 (3,6); 1,0215<br>(6,6); 1,0055 (6,2); -0,0002 (6,4) |
| I-075 |  | I-075: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2243 (2,2); 8,2543 (2,4); 7,9308<br>(1,5); 7,9270 (1,0); 7,8173 (0,8); 7,7979<br>(1,0); 7,7835 (0,6); 7,7788 (0,5); 7,7615<br>(0,9); 7,6946 (1,0); 7,6751 (1,3); 7,6556<br>(0,5); 4,0059 (8,7); 3,9695 (7,8); 3,8263<br>(0,6); 3,8080 (1,8); 3,7894 (1,8); 3,7710<br>(0,6); 3,3204 (14,0); 2,5237 (0,7); 2,5102<br>(16,1); 2,5059 (34,0); 2,5014 (46,0);   |

|       |   |  |
|-------|---|--|
|       |   | 2,4970 (33,4); 2,4926 (16,1); 2,0858 (1,7); 1,7651 (16,0); 1,6392 (0,5); 1,3972 (2,2); 1,3474 (2,0); 1,3290 (4,4); 1,3105 (1,9); -0,0002 (9,0)   |
| I-076 |    | I-076: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2151 (2,5); 8,2409 (2,6); 7,5986 (1,5); 7,5786 (1,8); 7,3953 (1,6); 7,3706 (0,9); 7,3658 (0,8); 7,3506 (0,8); 7,3458 (0,7); 4,0136 (10,2); 3,8698 (0,6); 3,8512 (2,0); 3,8327 (2,1); 3,8144 (0,6); 3,7292 (9,4); 3,3193 (45,4); 2,6747 (0,6); 2,6702 (0,8); 2,6656 (0,6); 2,5236 (1,8); 2,5187 (2,8); 2,5101 (50,3); 2,5056 (107,4); 2,5011 (144,8); 2,4966 (103,1); 2,4921 (48,7); 2,3325 (0,6); 2,3278 (0,8); 2,3234 (0,6); 2,2684 (7,4); 2,0855 (0,7); 1,8503 (0,7); 1,8374 (2,0); 1,8301 (2,2); 1,8189 (0,9); 1,6437 (0,8); 1,6314 (2,1); 1,6242 (2,2); 1,6106 (0,7); 1,3975 (16,0); 1,3441 (2,3); 1,3257 (5,2); 1,3072 (2,2); 0,0079 (0,9); -0,0003 (30,0); -0,0086 (1,0)   |
| I-077 |  | I-077: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2241 (3,9); 8,2528 (4,1); 7,8672 (1,9); 7,8630 (3,2); 7,8590 (2,1); 7,7388 (2,0); 7,7349 (3,4); 7,7310 (2,0); 7,6107 (2,0); 7,6061 (3,6); 7,6015 (1,8); 6,7479 (0,4); 6,7437 (0,4); 6,7360 (0,5); 6,7203 (0,4); 4,0202 (0,4); 4,0046 (16,0); 3,9536 (14,2); 3,8202 (0,9); 3,8019 (3,2); 3,7834 (3,2); 3,7649 (1,0); 3,3199 (48,7); 2,6749 (0,6); 2,6705 (0,9); 2,6658 (0,6); 2,5238 (2,0); 2,5189 (3,2); 2,5103 (54,7); 2,5059 (116,3); 2,5014 (156,8); 2,4968 (111,1); 2,4923 (52,2); 2,3326 (0,6); 2,3281 (0,9); 2,3236 (0,6); 2,0857 (1,4); 1,8690 (1,0); 1,8556 (2,9); 1,8481 (3,3); 1,8367 (1,5); 1,7367 (0,6); 1,7295 (0,5); 1,7176 (1,7); 1,7055 (3,2); 1,6982 (3,0); 1,6842 (1,0); 1,5142 (0,5); 1,5071 (0,5); 1,3975 (2,8); 1,3468 (3,5); 1,3284 (8,1); 1,3099 (3,5); 0,0080 (1,0); -0,0001 (33,4); -0,0085 (1,1) |
| I-078 |  | I-078: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2218 (2,1); 8,2444 (2,3); 7,8668 (1,4); 7,8514 (0,7); 7,8314 (1,3); 7,7912 (0,9); 7,7708 (0,5); 4,0259 (7,9); 3,8836 (0,5); 3,8652 (1,7); 3,8467 (1,8); 3,8283 (0,5); 3,7553 (7,4); 3,3203 (8,8); 2,5065 (20,4); 2,5022 (27,2); 2,4978 (20,1);   |

|       |   |   |
|-------|---|---|
|       |   | 2,3586 (6,2); 1,3974 (16,0); 1,3581 (1,9); 1,3397 (4,1); 1,3212 (1,8); 0,0072 (0,9); -0,0002 (23,2); -0,0083 (1,0)  |
| I-079 |    | I-079: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2298 (3,9); 8,4680 (3,1); 8,4627 (3,3); 8,2512 (4,2); 8,1826 (1,6); 8,1772 (1,6); 8,1613 (2,0); 8,1559 (2,0); 8,0072 (3,4); 7,9859 (2,7); 5,7561 (6,5); 4,0208 (16,0); 3,9858 (14,5); 3,9687 (0,5); 3,8405 (1,0); 3,8221 (3,3); 3,8036 (3,4); 3,7851 (1,0); 3,3224 (21,5); 2,5250 (0,5); 2,5115 (13,9); 2,5071 (29,6); 2,5026 (40,3); 2,4981 (29,6); 2,4936 (14,7); 2,0866 (1,5); 1,3527 (3,6); 1,3344 (8,2); 1,3158 (3,5); 0,0079 (0,9); -0,0002 (30,6); -0,0084 (1,4)   |
| I-080 |   | I-080: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2312 (3,5); 8,4459 (1,4); 8,4250 (4,5); 8,3743 (1,7); 8,3705 (1,4); 8,3539 (0,9); 8,3508 (0,9); 8,2557 (3,7); 5,7562 (8,2); 4,3317 (0,5); 4,0394 (0,4); 4,0321 (0,5); 4,0181 (16,0); 4,0135 (14,2); 3,8444 (0,9); 3,8261 (3,0); 3,8076 (3,0); 3,7892 (0,9); 3,7649 (0,4); 3,3287 (16,5); 2,5228 (0,4); 2,5141 (6,7); 2,5097 (14,2); 2,5052 (19,1); 2,5007 (13,8); 2,4962 (6,6); 2,0882 (2,2); 1,3967 (0,5); 1,3623 (3,3); 1,3439 (7,3); 1,3254 (3,1); 0,0079 (0,8); -0,0002 (23,5); -0,0085 (0,9)   |
| I-081 |  | I-081: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2215 (4,3); 8,2456 (4,4); 8,0725 (4,0); 7,9909 (3,6); 4,0183 (16,0); 3,8687 (1,0); 3,8505 (3,3); 3,8320 (3,4); 3,8135 (1,1); 3,8025 (0,8); 3,7785 (14,4); 3,7538 (0,6); 3,3199 (113,3); 2,6750 (0,8); 2,6705 (1,1); 2,6661 (0,9); 2,5239 (2,8); 2,5191 (4,4); 2,5104 (69,6); 2,5060 (147,5); 2,5016 (199,4); 2,4970 (144,4); 2,4926 (69,9); 2,4616 (0,8); 2,3571 (0,6); 2,3386 (12,2); 2,3286 (1,7); 2,3237 (1,1); 2,1115 (0,5); 1,3977 (1,4); 1,3612 (3,6); 1,3428 (8,0); 1,3243 (3,5); 1,3133 (0,5); 0,1459 (0,4); 0,0078 (3,1); -0,0003 (97,3); -0,0084 (3,9); -0,1497 (0,4) |

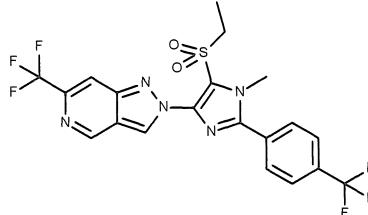
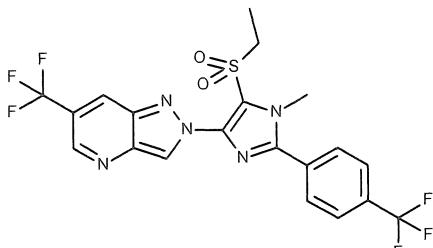
|       |   |   |
|-------|---|---|
| I-082 |    | I-082: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta=9,2301\text{ (3,8)}; 8,2542\text{ (4,1)}; 8,2360\text{ (2,9)}; 8,2278\text{ (3,4)}; 8,2239\text{ (3,5)}; 8,2159\text{ (3,4)}; 8,0167\text{ (2,0)}; 8,0130\text{ (1,9)}; 7,9964\text{ (1,6)}; 7,9926\text{ (1,7)}; 4,0142\text{ (16,0)}; 3,9967\text{ (14,3)}; 3,8421\text{ (0,9)}; 3,8238\text{ (3,2)}; 3,8053\text{ (3,3)}; 3,7869\text{ (1,0)}; 3,3208\text{ (85,1)}; 2,6753\text{ (0,6)}; 2,6708\text{ (0,9)}; 2,6665\text{ (0,7)}; 2,5241\text{ (2,3)}; 2,5193\text{ (3,6)}; 2,5107\text{ (54,0)}; 2,5063\text{ (114,0)}; 2,5018\text{ (153,4)}; 2,4972\text{ (110,0)}; 2,4928\text{ (52,5)}; 2,3330\text{ (0,6)}; 2,3285\text{ (0,9)}; 2,3240\text{ (0,6)}; 2,0742\text{ (1,1)}; 1,3511\text{ (3,5)}; 1,3326\text{ (8,0)}; 1,3141\text{ (3,4)}; -0,0001\text{ (8,1)}$ |
| I-083 |   | I-083: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta=9,2240\text{ (3,7)}; 8,2504\text{ (4,0)}; 8,2486\text{ (4,0)}; 8,1531\text{ (3,1)}; 8,1319\text{ (4,4)}; 8,0292\text{ (4,3)}; 8,0079\text{ (3,2)}; 4,0216\text{ (16,0)}; 3,9029\text{ (0,9)}; 3,8844\text{ (3,1)}; 3,8660\text{ (3,2)}; 3,8475\text{ (0,9)}; 3,7865\text{ (14,7)}; 3,3210\text{ (19,9)}; 2,6756\text{ (0,3)}; 2,6709\text{ (0,5)}; 2,6665\text{ (0,4)}; 2,5244\text{ (1,2)}; 2,5197\text{ (2,0)}; 2,5110\text{ (30,0)}; 2,5065\text{ (64,5)}; 2,5020\text{ (87,6)}; 2,4974\text{ (63,4)}; 2,4929\text{ (30,6)}; 2,3332\text{ (0,4)}; 2,3288\text{ (0,5)}; 2,3243\text{ (0,4)}; 2,0742\text{ (2,4)}; 1,3544\text{ (3,4)}; 1,3360\text{ (8,0)}; 1,3174\text{ (3,4)}; -0,0002\text{ (5,1)}$   |
| I-084 |  | I-084: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta=9,1935\text{ (4,3)}; 8,3173\text{ (0,4)}; 8,2096\text{ (4,6)}; 5,7570\text{ (1,5)}; 4,3702\text{ (0,5)}; 4,0246\text{ (0,5)}; 3,9591\text{ (16,0)}; 3,8671\text{ (14,5)}; 3,7565\text{ (0,4)}; 3,7196\text{ (1,1)}; 3,7011\text{ (3,8)}; 3,6828\text{ (3,6)}; 3,6644\text{ (1,1)}; 3,3269\text{ (5,2)}; 2,8875\text{ (1,2)}; 2,8687\text{ (3,7)}; 2,8500\text{ (3,8)}; 2,8313\text{ (1,3)}; 2,5083\text{ (13,9)}; 2,5041\text{ (18,3)}; 2,5000\text{ (13,9)}; 1,3298\text{ (4,1)}; 1,3112\text{ (8,6)}; 1,2924\text{ (4,0)}; 1,2736\text{ (3,8)}; 1,2553\text{ (8,1)}; 1,2368\text{ (3,8)}; -0,0002\text{ (0,7)}$  |
| I-085 |  | I-085: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta=9,1902\text{ (4,3)}; 8,2077\text{ (4,6)}; 5,7571\text{ (7,5)}; 3,9466\text{ (16,0)}; 3,8932\text{ (14,3)}; 3,7211\text{ (1,1)}; 3,7027\text{ (3,5)}; 3,6842\text{ (3,6)}; 3,6658\text{ (1,1)}; 3,3292\text{ (4,0)}; 2,9561\text{ (2,0)}; 2,9376\text{ (3,6)}; 2,9189\text{ (2,2)}; 2,5099\text{ (9,9)}; 2,5057\text{ (12,8)}; 2,5014\text{ (9,5)}; 1,6981\text{ (1,1)}; 1,6800\text{ (2,8)}; 1,6616\text{ (2,8)}; 1,6435\text{ (1,1)}; 1,2741\text{ (3,7)}; 1,2558\text{ (8,1)}; 1,2373\text{ (3,6)}; 0,8499\text{ (0,6)}; 0,8435\text{ (0,6)}; 0,8315\text{ (0,9)}; 0,8191\text{ (0,6)}; 0,8130\text{ (0,6)}; 0,8000\text{ (0,3)}$  |

|       |   |  |
|-------|---|--|
|       |   | 0,4441 (0,8); 0,4335 (2,5); 0,4299 (2,6);<br>0,4245 (1,3); 0,4199 (1,3); 0,4136 (2,4);<br>0,4100 (2,4); 0,3999 (0,8); 0,0771 (0,9);<br>0,0641 (3,2); 0,0523 (3,0); 0,0408 (0,7);<br>0,0078 (0,6); -0,0002 (13,3)   |
| I-086 |    | I-086: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,1930 (3,7); 8,2050 (3,9); 8,2034 (4,0); 5,7583 (12,4); 4,3773 (0,6); 3,9576 (16,0); 3,9141 (14,3); 3,7341 (1,5); 3,7154 (3,4); 3,6969 (3,4); 3,6785 (1,0); 3,3410 (0,5); 3,3334 (6,4); 3,3243 (1,1); 3,3072 (1,4); 3,2903 (1,1); 3,2733 (0,4); 2,5155 (3,5); 2,5111 (7,4); 2,5066 (9,9); 2,5021 (7,1); 2,4976 (3,4); 1,3244 (14,8); 1,3074 (14,3); 1,2978 (1,1); 1,2776 (3,6); 1,2592 (8,0); 1,2407 (3,5); 0,0079 (0,4); -0,0002 (12,2); -0,0085 (0,5)  |
| I-087 |  | I-087: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2227 (3,9); 8,2490 (4,1); 7,7702 (1,4); 7,7669 (1,0); 7,7551 (1,0); 7,7514 (1,9); 7,7482 (1,3); 7,7286 (1,7); 7,7245 (2,7); 7,6510 (1,0); 7,6315 (2,4); 7,6127 (1,7); 7,5958 (1,4); 7,5921 (2,0); 7,5881 (1,4); 7,5760 (0,7); 7,5721 (0,9); 7,5682 (0,7); 5,7552 (3,7); 4,0078 (16,0); 3,9638 (0,6); 3,9524 (14,2); 3,8280 (1,0); 3,8096 (3,2); 3,7911 (3,3); 3,7726 (1,0); 3,3227 (21,7); 2,5249 (0,6); 2,5115 (15,0); 2,5071 (31,5); 2,5026 (42,2); 2,4981 (30,4); 2,4937 (14,7); 2,0864 (7,2); 1,9892 (0,7); 1,8453 (1,1); 1,8323 (3,4); 1,8251 (3,6); 1,8136 (1,4); 1,6454 (1,5); 1,6331 (3,4); 1,6261 (3,5); 1,6125 (1,1); 1,3972 (1,0); 1,3475 (3,6); 1,3290 (8,2); 1,3105 (3,5); 1,1754 (0,4); 0,0079 (0,8); -0,0002 (23,2); -0,0084 (0,9) |
| I-088 |  | I-088: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,2274 (2,5); 8,2510 (2,7); 8,1010 (1,5); 8,0847 (1,0); 8,0797 (4,1); 8,0508 (4,0); 8,0459 (1,1); 8,0340 (0,7); 8,0294 (1,6); 4,0154 (10,4); 3,9904 (9,5); 3,8461 (0,6); 3,8276 (2,1); 3,8091 (2,2); 3,7907 (0,6); 3,3213 (15,2); 2,5247 (0,7); 2,5199 (1,2); 2,5112 (15,6); 2,5068 (32,7); 2,5023 (43,7); 2,4978 (31,6); 2,4934 (15,4); 1,3975 (16,0); 1,3509 (2,4); 1,3324 (5,3); 1,3139 (2,3); 0,0079 (1,3); -0,0002 (38,0); -0,0085 (1,6)   |

|       |  |   |
|-------|--|---|
| I-089 |  | I-089: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2295 (3,7); 8,3312 (1,6); 8,3273 (2,8); 8,3241 (1,8); 8,2507 (3,9); 8,1761 (0,9); 8,1730 (1,4); 8,1691 (1,0); 8,1563 (1,1); 8,1523 (1,5); 8,1493 (1,2); 8,0995 (1,0); 8,0961 (1,5); 8,0929 (1,0); 8,0799 (1,2); 8,0765 (1,7); 8,0733 (1,1); 7,8406 (1,4); 7,8210 (2,5); 7,8012 (1,1); 4,0229 (16,0); 3,9835 (14,6); 3,8442 (1,0); 3,8259 (3,2); 3,8074 (3,2); 3,7889 (1,0); 3,3200 (42,3); 2,6753 (0,5); 2,6709 (0,7); 2,6663 (0,5); 2,5242 (2,2); 2,5195 (3,4); 2,5108 (41,3); 2,5064 (86,2); 2,5018 (115,2); 2,4973 (82,7); 2,4928 (39,8); 2,3331 (0,5); 2,3286 (0,7); 2,3240 (0,5); 2,0860 (6,7); 1,3977 (9,2); 1,3537 (3,5); 1,3353 (8,1); 1,3167 (3,4); 0,1459 (0,4); 0,0079 (3,7); -0,0002 (108,4); -0,0085 (4,3); -0,1497 (0,4)  |
| I-090 |  | I-090: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,2242 (4,1); 9,2097 (0,4); 8,3091 (0,4); 8,2522 (4,4); 8,2276 (0,4); 8,0485 (1,7); 7,9009 (2,7); 7,8820 (2,7); 7,8556 (2,7); 7,8313 (2,7); 7,7717 (1,6); 5,7558 (6,9); 4,0580 (0,3); 4,0137 (16,0); 3,9927 (1,6); 3,9638 (1,3); 3,9218 (0,6); 3,8725 (1,1); 3,8542 (11,4); 3,8356 (3,6); 3,8171 (1,1); 3,8090 (0,5); 3,7897 (0,4); 3,3198 (85,4); 2,6751 (0,8); 2,6706 (1,2); 2,6661 (0,9); 2,5238 (2,6); 2,5190 (4,0); 2,5103 (70,7); 2,5060 (151,6); 2,5015 (206,4); 2,4970 (149,0); 2,4926 (71,7); 2,3326 (0,8); 2,3282 (1,2); 2,3238 (0,9); 1,3423 (3,7); 1,3238 (8,3); 1,3054 (3,8); 1,2844 (0,6); 1,2657 (1,0); 1,2589 (0,7); 1,2471 (0,7); 1,2350 (1,6); 1,1773 (0,3); 1,1589 (0,5); 1,1400 (0,3); 0,8551 (0,5); 0,1460 (0,4); 0,0080 (2,8); -0,0001 (88,4); -0,0083 (3,3); -0,1496 (0,4) |
| I-091 |  | I-091: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,1979 (1,0); 9,2297 (4,0); 9,2225 (0,5); 9,2077 (0,5); 9,0182 (0,5); 8,5409 (2,7); 8,5229 (2,5); 8,4893 (2,8); 8,3144 (1,9); 8,2545 (4,2); 8,2429 (0,4); 8,2245 (0,4); 8,2012 (2,5); 8,1770 (2,6); 8,1131 (0,7); 7,6740 (0,3); 7,6449 (0,6); 7,6308 (0,7); 7,6262 (0,8); 7,6143 (0,7); 7,6104 (0,7); 7,5962 (0,9); 7,5725 (0,8); 7,5558   |

|       |  |   |
|-------|--|---|
|       |  | (1,4); 7,5213 (3,0); 7,5057 (2,2); 7,4649 (1,7); 7,4437 (1,7); 7,3816 (0,4); 7,3287 (0,6); 7,3097 (0,9); 7,2870 (0,6); 7,2536 (0,7); 7,2413 (0,6); 7,2248 (0,4); 6,7909 (3,6); 5,7546 (2,6); 4,0397 (0,4); 4,0193 (16,0); 3,9929 (1,8); 3,9829 (0,6); 3,9633 (1,4); 3,9578 (1,5); 3,9295 (0,4); 3,9220 (1,5); 3,8910 (1,2); 3,8741 (11,5); 3,8551 (3,3); 3,8373 (1,1); 3,8081 (0,5); 3,7897 (0,5); 3,7470 (0,4); 3,7286 (0,5); 3,5851 (0,4); 3,5759 (0,4); 3,5567 (0,4); 3,5492 (0,4); 3,4381 (0,6); 3,4227 (1,2); 3,4081 (0,7); 3,3927 (1,2); 3,3185 (302,2); 3,2105 (0,4); 3,0637 (0,3); 2,6751 (3,8); 2,6705 (5,3); 2,6660 (4,1); 2,6481 (0,4); 2,6270 (0,3); 2,6210 (0,4); 2,6123 (0,4); 2,5933 (0,4); 2,5748 (0,6); 2,5239 (13,2); 2,5103 (321,8); 2,5060 (681,8); 2,5015 (923,6); 2,4969 (666,6); 2,4925 (320,0); 2,4555 (0,9); 2,3326 (3,8); 2,3282 (5,3); 2,3237 (4,0); 1,3472 (3,6); 1,3287 (8,2); 1,3102 (3,6); 1,2898 (0,5); 1,2839 (0,6); 1,2718 (0,8); 1,2658 (1,1); 1,2548 (0,5); 1,2475 (0,6); 1,2328 (0,9); 1,2137 (0,8); 1,1943 (0,4); 1,0327 (0,4); 1,0205 (0,6); 0,0078 (1,3); -0,0001 (45,6); -0,0083 (1,9) |
| I-092 |  | I-092: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,9758 (5,2); 8,1939 (3,2); 8,0633 (2,1); 8,0415 (2,2); 7,8596 (4,4); 7,8384 (5,6); 7,6945 (5,6); 7,6734 (4,4); 7,3719 (2,0); 7,3500 (1,9); 6,5552 (0,6); 3,9526 (16,0); 3,8278 (1,2); 3,8093 (3,9); 3,7910 (3,9); 3,7724 (1,4); 3,3199 (72,8); 2,6699 (1,9); 2,5043 (217,4); 2,5010 (276,8); 2,3279 (1,6); 2,0743 (1,1); 1,3451 (4,1); 1,3266 (8,8); 1,3082 (4,0); 1,2349 (0,4); 0,1459 (0,7); -0,0003 (134,9); -0,1495 (0,6)  |
| I-093 |  | I-093: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 12,5210 (0,5); 11,5637 (0,4); 9,9892 (0,5); 9,4469 (3,7); 9,3139 (5,1); 8,2806 (3,5); 7,8688 (4,4); 7,8404 (5,9); 7,7026 (6,1); 7,6741 (4,3); 6,5226 (1,0); 3,9658 (16,0); 3,7828 (1,2); 3,7591 (3,7); 3,7342 (3,8); 3,7101 (1,3); 3,3183 (840,6); 3,2498 (0,7); 3,2110 (0,5); 2,9361 (0,5); 2,7328 (2,9); 2,7269 (4,0); 2,7209 (2,8); 2,6131 (0,5); 2,5129 (256,1); 2,5069   |

|       |  |   |
|-------|--|---|
|       |  | (526,6); 2,5009 (718,3); 2,4948 (518,7); 2,4889 (241,9); 2,4235 (0,7); 2,3348 (0,6); 2,3068 (0,6); 2,2768 (2,8); 2,2709 (4,2); 2,2653 (3,0); 1,3326 (3,8); 1,3082 (9,1); 1,2836 (3,8); 1,1485 (0,9); 0,4356 (0,5); 0,1949 (1,5); 0,0107 (17,1); -0,0001 (400,8); -0,0111 (14,1); -0,1988 (1,7)  |
| I-094 |  | I-094: $^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,3498 (4,9); 9,3477 (5,0); 8,9284 (3,1); 8,9217 (3,4); 8,8299 (2,5); 8,8268 (2,7); 7,8726 (4,2); 7,8665 (1,6); 7,8441 (6,0); 7,7033 (6,0); 7,6747 (4,3); 3,9692 (16,0); 3,8081 (1,0); 3,7833 (3,6); 3,7587 (3,8); 3,7339 (1,1); 3,4012 (0,3); 3,3855 (0,4); 3,3694 (0,7); 3,3325 (433,4); 3,3019 (1,2); 3,2914 (0,7); 2,5136 (12,1); 2,5078 (24,3); 2,5019 (32,5); 2,4961 (22,8); 2,0739 (0,4); 1,3465 (4,0); 1,3220 (9,1); 1,2974 (3,9); 1,0095 (0,3); -0,0005 (14,4); -0,0114 (0,6)  |
| I-095 |  | I-095: $^1\text{H-NMR}$ (300,2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,4483 (3,7); 9,3168 (5,0); 8,2814 (3,5); 7,8352 (2,0); 7,8273 (2,4); 7,8154 (3,0); 7,8029 (2,7); 7,6280 (6,2); 7,6196 (5,3); 7,6057 (3,5); 3,9724 (16,0); 3,7887 (1,1); 3,7638 (3,7); 3,7390 (3,9); 3,7149 (1,1); 3,3181 (77,2); 2,7261 (0,6); 2,5127 (45,9); 2,5069 (93,4); 2,5009 (127,1); 2,4949 (92,8); 2,4891 (43,8); 2,2709 (0,8); 2,0741 (0,7); 1,3349 (4,0); 1,3104 (9,1); 1,2857 (3,9); 0,1952 (0,4); 0,0421 (0,4); 0,0107 (3,5); -0,0002 (79,7); -0,0110 (2,8); -0,1989 (0,4)  |
| I-096 |  | I-096: $^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,3515 (4,8); 8,9284 (2,9); 8,9218 (3,5); 8,8261 (2,8); 7,8759 (0,7); 7,8305 (2,6); 7,8177 (3,2); 7,8048 (2,6); 7,7859 (0,8); 7,6525 (1,1); 7,6289 (6,0); 7,6205 (5,7); 7,6099 (3,5); 7,5598 (0,7); 7,0080 (0,7); 6,2686 (0,8); 4,7230 (0,7); 4,0114 (0,9); 3,9749 (16,0); 3,8103 (1,2); 3,7858 (4,0); 3,7621 (3,7); 3,7379 (1,6); 3,7162 (0,8); 3,4318 (1,0); 3,4168 (1,9); 3,3238 (1144,8); 3,2267 (3,6); 3,2099 (1,2); 2,7260 (1,2); 2,5068 (138,8); 2,5009 (181,9); 2,4951 (128,0); 2,2715 (1,0); 1,3476 (4,3); 1,3231 (8,8); 1,2991 (3,6); 0,1297 (0,7); 0,0361 (1,0); 0,0103 (5,1); - |

|       |  |  |
|-------|--|--|
|       |  | 0,0005 (101,9); -0,0115 (3,1); -3,2022 (0,7)   |
| I-097 |   | I-097: $^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,4549 (4,0); 9,3257 (5,2); 8,2888 (3,8); 8,0848 (2,4); 8,0574 (4,8); 8,0027 (5,1); 7,9743 (2,6); 4,0001 (16,0); 3,8021 (1,1); 3,7772 (3,8); 3,7527 (3,8); 3,7283 (1,2); 3,3256 (45,6); 2,5075 (34,3); 2,5017 (45,1); 2,4959 (31,4); 1,3445 (4,1); 1,3200 (9,2); 1,2954 (3,9); -0,0004 (2,6)   |
| I-098 |  | I-098: $^1\text{H-NMR}$ (300,1 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 13,0683 (0,8); 10,3906 (0,8); 9,3609 (4,8); 8,9336 (3,1); 8,9273 (3,2); 8,8369 (2,8); 8,0875 (2,5); 8,0603 (4,8); 8,0035 (4,8); 7,9751 (3,1); 7,6151 (0,9); 4,0026 (16,0); 3,8258 (1,3); 3,7984 (4,2); 3,7743 (3,6); 3,4524 (1,0); 3,4283 (1,1); 3,4017 (1,3); 3,3289 (255,1,4); 3,2812 (3,0); 3,2607 (1,9); 3,2512 (1,9); 3,2207 (0,9); 3,2113 (0,9); 3,2038 (0,8); 3,1769 (0,9); 2,9440 (0,8); 2,7272 (1,7); 2,5130 (86,8); 2,5072 (170,2); 2,5013 (224,9); 2,4954 (155,3); 2,4386 (0,8); 2,4274 (0,8); 2,2716 (1,4); 2,2648 (1,2); 2,0734 (2,1); 1,3570 (4,2); 1,3324 (9,6); 1,3079 (3,8); 0,0295 (0,8); 0,0103 (5,3); -0,0004 (115,2); -0,0115 (3,1) |

### Dữ liệu NMR của các ví dụ được chọn

#### Phương pháp danh sách pic NMR

Dữ liệu 1H-NMR của các ví dụ được chọn được lưu ý ở dạng danh sách pic 1H-NMR. Đối với mỗi pic tín hiệu, thứ nhất trị số δ tính theo ppm và sau đó, cường độ tín hiệu trong dấu ngoặc tròn được liệt kê. Các cặp trị số δ–số cường độ tín hiệu đối với các pic tín hiệu khác nhau được liệt kê tách nhau bằng dấu chấm phẩy.

Do đó, danh sách pic đối với một ví dụ có dạng:

δ<sub>1</sub> (cường độ<sub>1</sub>); δ<sub>2</sub> (cường độ<sub>2</sub>);.....; δ<sub>i</sub> (cường độ<sub>i</sub>);.....; δ<sub>n</sub> (cường độ<sub>n</sub>)

Cường độ của các tín hiệu rõ rệt liên quan đến chiều cao của tín hiệu trong ví dụ in sẵn của phô NMR tính theo cm và thể hiện tỷ lệ đúng của các cường độ tín hiệu. Trong trường hợp tín hiệu rộng, một số pic hoặc ở giữa của tín hiệu và cường độ tương đối của nó có thể được thể hiện so với tín hiệu mạnh nhất trong phô.

Để hiệu chỉnh độ dịch chuyển hóa học của phô 1H NMR, sử dụng tetrametylilan và/hoặc độ dịch chuyển hóa học của dung môi, đặc biệt là trong trường hợp phô được đo trong DMSO. Do đó, pic tetrametylilan có thể nhưng không nhất thiết phải xuất hiện trong danh sách pic NMR.

Các danh sách của các pic 1H NMR là tương tự như các bản in 1H NMR thông thường và do đó, thường chứa tất cả các pic được liệt kê trong sự thể hiện NMR thông thường.

Ngoài ra, như các bản in 1H NMR thông thường, chúng có thể thể hiện các tín hiệu dung môi, các tín hiệu của các chất đồng phân lập thể của các hợp chất đích, mà tương tự như vậy tạo nên đối tượng theo sáng chế, và/hoặc các pic tạp chất.

Trong việc báo cáo các tín hiệu của hợp chất trong khoảng delta của dung môi và/hoặc nước, danh sách các pic 1H NMR thể hiện pic dung môi thông dụng, ví dụ, các pic của DMSO trong DMSO-D<sub>6</sub> và pic của nước, mà thường có cường độ trung bình cao.

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

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc các tạp chất như vậy có thể là đặc thù của quy trình điều chế cụ thể. Do đó, các pic của chúng có thể giúp xác nhận khả năng lắp lại của quy trình điều chế dựa vào "dấu vân tay của sản phẩm phụ".

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này tính toán các pic của các hợp chất đích bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, còn cả bằng các trị số kỳ vọng được đánh giá thực tế) có thể, nếu cần, tách các pic của các hợp chất đích, tùy ý sử dụng bộ lọc cường độ bổ sung. Việc tách này sẽ tương tự như việc lựa chọn pic liên quan trong sự thể hiện 1H NMR thông thường.

Chi tiết hơn nữa về danh sách pic 1H NMR có thể được tìm thấy trong cơ sở dữ liệu bộc lộ nghiên cứu (Research Disclosure Database) số 564025.

### Các ví dụ sử dụng

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

Đối với lớp phủ của các ống thử nghiệm, 9 mg thành phần hoạt tính trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 µl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống thủy tinh thể tích 25 ml bằng cách xoay và lắc trên máy lắc quỹ đạo (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch

thành phần hoạt tính và diện tích bề mặt bên trong 44,7 cm<sup>2</sup>, dựa trên sự phân bố đồng đều, đạt được liều theo diện tích là 5 µg/cm<sup>2</sup>.

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

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu đạt được hiệu quả ít nhất 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng là 5 µg/cm<sup>2</sup>. Hiệu quả 100% có nghĩa là toàn bộ bọ chét bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là không có bọ chét nào bị tổn hại.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất dưới đây từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng là 5 µg/cm<sup>2</sup> (=500 g/ha): I-003, I-005, I-007, I-009, I-011, I-013, I-014, I-015, I-018, I-019, I-020, I-022, I-023

#### Boophilus microplus – thử nghiệm tiêm

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa thành phần hoạt tính thích hợp, 10 mg thành phần hoạt tính được trộn với 0,5 ml dung môi và dịch cô đặc được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng dung môi.

1 µl dung dịch thành phần hoạt tính được tiêm vào trong bụng của 5 con tích gia súc cái trưởng thành đã được cho ăn no (*Boophilus microplus*). Các con tích được chuyển vào trong các đĩa và được giữ trong phòng được kiểm soát khí hậu.

Hiệu lực được đánh giá sau 7 ngày bằng cách để trứng hữu thụ. Trứng mà rõ ràng không hữu thụ được bảo quản trong tủ được kiểm soát khí hậu cho đến khi áu trùng nở sau khoảng 42 ngày. Hiệu quả 100% có nghĩa là không có tích để trứng hữu thụ bất kỳ; 0% có nghĩa là tất cả trứng là hữu thụ.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 µg/con: I-041

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 µg/con: I-016

**Ctenocephalides felis - thử nghiệm dùng qua đường miếng**

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra ché phẩm chứa thành phần hoạt tính thích hợp, 10 mg thành phần hoạt tính được trộn với 0,5 ml dimetyl sulfoxit. Tiến hành pha loãng bằng máu gia súc đã xử lý bằng xitrat để thu được nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 bọ chét mèo trưởng thành (*Ctenocephalides felis*) chưa được cho ăn được đặt vào khoang được đậy kín ở đỉnh và đáy bằng gạc. Một cột trụ bằng kim loại mà đáy của nó được đậy kín bằng parafilm được đặt lên trên khoang này. Cột trụ này chứa máu/ché phẩm chứa thành phần hoạt tính, mà có thể được bọ chét hút qua màng parafilm.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-003, I-005, I-011, I-013, I-014, I-015, I-018, I-020, I-023, I-033, I-038, I-039, I-055

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 95% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-007, I-009, I-019, I-022, I-029

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-040

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-025, I-049

**Thử nghiệm với Lucilia cuprina**

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra ché phẩm chứa thành phần hoạt tính thích hợp, 10 mg thành phần hoạt tính được trộn với 0,5 ml dimetyl sulfoxit, và dịch cô đặc được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Khoảng 20 áu trùng L1 của nhặng cùu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào bình thử nghiệm chứa thịt ngựa băm và ché phẩm chứa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-001, I-003, I-005, I-007, I-008, I-009, I-011, I-012, I-013, I-014, I-015, I-016, I-018, I-019, I-020, I-022, I-023, I-030, I-033, I-040, I-043, I-049, I-055, I-092

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 95% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-029, I-046

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-021

### **Thử nghiệm với *Musca domestica***

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa thành phần hoạt tính thích hợp, 10 mg thành phần hoạt tính được trộn với 0,5 ml dimetyl sulfoxit, và dịch cô đặc được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn.

Các bình chứa bọt biển được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm chứa thành phần hoạt tính ở nồng độ mong muốn được đưa 10 con ruồi nhà trưởng thành (*Musca domestica*) vào.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-005, I-019

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-033

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ áp dụng là 100 ppm: I-009, I-014, I-018, I-049

### ***Myzus persicae* - thử nghiệm dùng qua đường miệng**

Dung môi: 100 phần khối lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm chứa thành phần hoạt tính thích hợp, 1 phần khối lượng của thành phần hoạt tính được hòa tan bằng các phần khối lượng xác định của dung môi và tạo ra nồng độ mong muốn bằng nước.

50 µl chế phẩm chứa thành phần hoạt tính được chuyển vào các đĩa vi chuẩn độ và pha đến thể tích cuối 200 µl bằng 150 µl môi trường IPL41 dùng cho côn trùng (33%

+ 15% đường). Sau đó, đậy kín các đĩa bằng màng parafilm, mà quấn thể hỗn hợp rệp đào xanh (*Myzus persicae*) trong đĩa vi chuẩn độ thứ hai có khả năng đục thủng qua và hút dịch.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 4 ppm: I-001, I-002, I-003, I-004, I-005, I-007, I-008, I-009, I-011, I-012, I-013, I-014, I-015, I-016, I-017, I-018, I-019, I-020, I-021, I-022, I-023, I-025, I-026, I-027, I-028, I-029, I-030, I-031, I-032, I-033, I-034, I-036, I-038, I-039, I-040, I-041, I-042, I-043, I-044, I-045, I-046, I-047, I-048, I-049, I-051, I-052, I-053, I-055, I-056, I-057, I-058, I-059, I-060, I-061, I-062, I-063, I-064, I-065, I-066, I-067, I-068, I-069, I-070, I-072, I-075, I-079, I-080, I-081, I-082, I-084, I-085, I-086, I-087, I-092, I-093, I-094, I-095, I-097, I-098

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 4 ppm: I-024, I-037, I-050, I-054, I-078, I-096

#### Myzus persicae - thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan bằng lượng dung môi đã định và được đưa đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-011, I-014, I-016, I-017, I-018, I-019, I-020, I-021, I-022, I-023, I-030, I-036, I-039, I-040, I-047, I-059, I-060, I-061, I-062, I-063, I-064, I-065, I-067, I-070, I-076

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-003, I-005, I-007, I-008, I-009, I-012, I-013, I-015, I-026, I-027, I-028, I-033, I-034, I-038, I-041, I-042, I-043, I-048, I-049, I-050, I-051, I-055, I-057, I-058, I-069, I-071, I-074, I-075, I-077, I-079, I-082, I-084, I-085, I-086, I-095, I-096

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-029, I-066

#### Phaedon cochleariae –thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan bằng lượng dung môi đã định và được đưa đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 500 g/ha: I-066

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-005, I-007, I-011, I-013, I-014, I-015, I-018, I-019, I-020, I-022, I-023, I-024, I-026, I-027, I-028, I-029, I-036, I-038, I-041, I-042, I-046, I-049, I-055, I-057, I-059, I-060, I-061, I-062, I-063, I-067, I-068, I-069, I-070, I-076, I-077, I-078, I-080, I-081, I-082, I-087, I-093, I-096, I-097, I-098

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-035, I-064, I-079, I-094

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 67% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-092

**Spodoptera frugiperda - thử nghiệm phun**

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan bằng lượng dung môi đã định và được đưa đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-005, I-007, I-011, I-014, I-015, I-019, I-024, I-025, I-027, I-033, I-063, I-069, I-076, I-078, I-081, I-087, I-092, I-093, I-094, I-095, I-097, I-098

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-018, I-020, I-060, I-070, I-082, I-096

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 67% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-057

**Tetranychus urticae – Thử nghiệm phun, kháng OP**

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan bằng lượng dung môi đã định và được đưa đến nồng độ mong muốn bằng nước chứa nồng độ chất nhũ hóa là 1000 ppm. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa lá đậu (*Phaseolus vulgaris*) được gây nhiễm mạt nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) ở mọi giai đoạn được phun chế phẩm chúa thành phần hoạt tính có nồng độ mong muốn.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-054, I-070, I-077, I-082, I-092

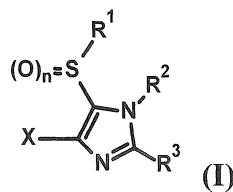
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-049, I-050, I-055, I-066, I-074, I-075, I-076, I-086

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 g/ha: I-082

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 g/ha: I-042, I-049, I-077, I-087

## YÊU CẦU BẢO HỘ

## 1. Hợp chất có công thức (I)



trong đó:

R<sup>1</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl,

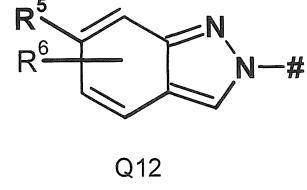
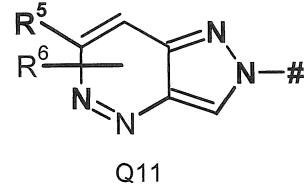
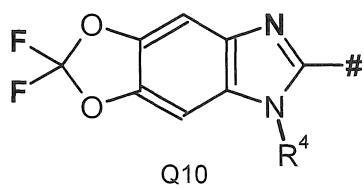
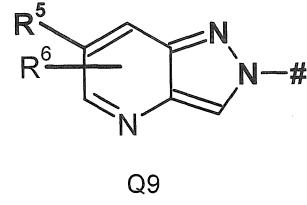
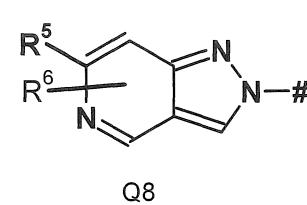
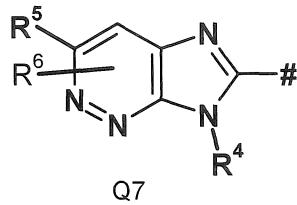
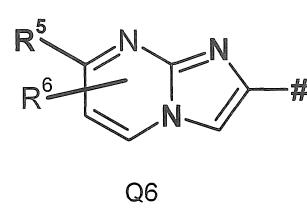
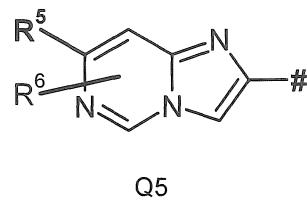
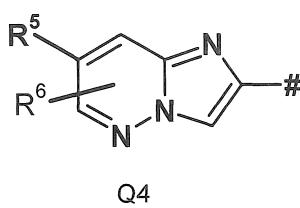
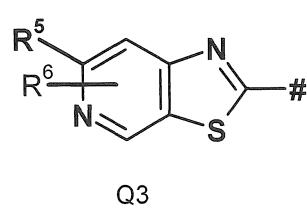
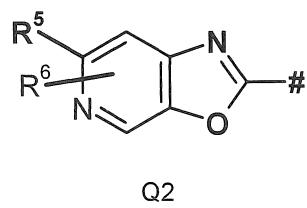
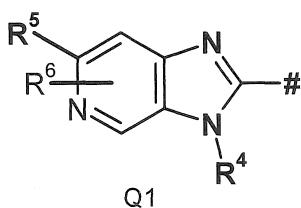
R<sup>3</sup> là hydro, halogen, xyano, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, SCN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonylamino.

$C_6$ )alkylaminocarbonylamino,  $(C_3-C_6)$ xcycloalkylaminocarbonylamino,  $(C_1-C_6)$ haloalkylaminocarbonylamino,  $(C_1-C_6)$ alkylaminocarbonyl- $(C_1-C_6)$ alkylamino, di( $C_1-C_6$ )alkylaminocarbonyl- $(C_1-C_6)$ alkylamino,  $(C_3-C_6)$ xcycloalkylaminocarbonyl- $(C_1-C_6)$ alkylamino hoăc  $(C_1-C_6)$ haloalkylaminocarbonyl- $(C_1-C_6)$ alkylamino,

hoặc là aryl, hetaryl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó nếu R<sup>3</sup> là hetaryl thì ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt, và trong đó các phần tử thê tùy ý là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsilyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino,

(C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, halo hetaryl, halo oxohetaryl, xyanohetaryl, xyano oxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q12



R<sup>4</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl,

R<sup>5</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkyl,

R<sup>6</sup> là hydro, và

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

$R^1$  là  $(C_1-C_4)$ alkyl,  $(C_1-C_4)$ xyanoalkyl,  $(C_1-C_4)$ alkoxy-( $C_1-C_4$ )alkyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkyl,  $(C_2-C_4)$ alkenyl, hoặc  $(C_2-C_4)$ alkynyl,

$R^2$  là hydro,  $(C_1-C_4)$ alkyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkyl,  $(C_1-C_4)$ xyanoalkyl,  $(C_1-C_4)$ hydroxyalkyl,  $(C_1-C_4)$ alkoxy-( $C_1-C_4$ )alkyl, hoặc  $(C_1-C_4)$ haloalkoxy-( $C_1-C_4$ )alkyl,

$R^3$  là hydro, halogen, xyano, nitro,  $(C_1-C_4)$ alkyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkyl,  $(C_1-C_4)$ alkoxy,  $(C_1-C_4)$ haloalkoxy,  $(C_1-C_4)$ alkylthio,  $(C_1-C_4)$ haloalkylthio,  $(C_1-C_4)$ alkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ alkylsulfonyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkylsulfonyl, SCN,  $(C_1-C_4)$ alkylcarbonyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkylcarbonyl,  $(C_1-C_4)$ alkoxycarbonyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl,  $(C_1-C_4)$ alkylaminocarbonyl, di( $C_1-C_4$ )alkylaminocarbonyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkylaminocarbonyl, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl,  $(C_1-C_4)$ alkylaminothiocarbonyl, di( $C_1-C_4$ )alkylaminothiocarbonyl,  $(C_1-C_4)$ haloalkylaminothiocarbonyl, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylaminothiocarbonyl, amino,  $(C_1-C_4)$ alkylamino,  $(C_1-C_4)$ haloalkylamino, di( $C_1-C_4$ )alkylamino, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylamino,  $(C_1-C_4)$ alkylsulfonylamino,  $(C_1-C_4)$ alkylcarbonylamino,  $(C_1-C_4)$ haloalkylcarbonylamino,  $(C_1-C_4)$ alkylcarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino,  $(C_1-C_4)$ haloalkylcarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylcarbonylamino, ( $C_1-C_4$ )alkylaminothiocarbonylamino, ( $C_1-C_4$ )alkylthiocarbonylamino,  $(C_1-C_4)$ haloalkylthiocarbonylamino, ( $C_1-C_4$ )alkylthiocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylthiocarbonylamino, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylthiocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino, ( $C_2-C_4$ )alkenyl,  $(C_2-C_4)$ haloalkenyl,  $(C_2-C_4)$ xyanoalkenyl,  $(C_3-C_6)$ xycloalkyl-( $C_2$ )alkenyl,  $(C_2-C_4)$ alkynyl,  $(C_2-C_4)$ haloalkynyl,  $(C_3-C_6)$ xycloalkyl-( $C_2$ )alkynyl,  $(C_3-C_6)$ xycloalkyl-( $C_1-C_4$ )alkyl,  $(C_1-C_4)$ alkylaminocarbonylamino, di( $C_1-C_4$ )alkylaminocarbonylamino,  $(C_3-C_6)$ xycloalkylaminocarbonylamino, ( $C_1-C_4$ )haloalkylaminocarbonylamino, ( $C_1-C_4$ )alkylaminocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino, di( $C_1-C_4$ )alkylaminocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino, ( $C_3-C_6$ )xycloalkylaminocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino hoặc ( $C_1-C_4$ )haloalkylaminocarbonyl-( $C_1-C_4$ )alkylamino,

hoặc là aryl, hetaryl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó nếu  $R^3$  là hetaryl thì ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt, và trong đó các phần tử thê tùy ý là như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, SCN, SF<sub>5</sub>, tri( $C_1-C_4$ )alkylsilyl, ( $C_3-C_6$ )xycloalkyl, ( $C_3-C_6$ )xycloalkyl-( $C_3-C_6$ )xycloalkyl,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylsulfonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, di(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, hetaryl, oxohetaryl, halohetaryl, haloxxohetaryl, xyanohetaryl, xyanoxxohetaryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylhetaryl hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyloxohetaryl,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm từ Q1 đến Q12,

R<sup>4</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl,

R<sup>5</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl,

R<sup>6</sup> là hydro, và

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

R<sup>1</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl,

R<sup>2</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, hoặc (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl,

R<sup>3</sup> là hydro, halogen, xyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkoxy, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl,

hoặc là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, furanyl, pyrazolyl, thiazolyl, oxazolyl, imidazolyl, pyrrolyl, xyclopentenyl hoặc xyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau, trong đó nếu R<sup>3</sup> là hetaryl thì ít nhất một nhóm carbonyl có thê tùy ý có mặt, và trong đó các phần tử thê tùy ý là như sau: xyano, halogen (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, xyano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hydroxyalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkynyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl,

C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylaminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylsulfonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylamino, aminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminosulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylcarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)xycloalkylcarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonylamino hoặc (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkylthiocarbonyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)alkylamino,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng ngưng tụ từ nhóm Q1, Q2, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11 hoặc Q12,

R<sup>4</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, hoặc (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl,

R<sup>5</sup> là (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl,

R<sup>6</sup> là hydro, và

n bằng 0, 1 hoặc 2.

#### 4. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó

R<sup>1</sup> là methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, cyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafoetyl,

R<sup>2</sup> là hydro, methyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafoetyl,

R<sup>3</sup> là hydro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)xyanoalkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkenyl, halogen, xyano, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>2</sub>)alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)xycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylaminocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalkylaminothiocarbonyl,

$C_4)$ alkylaminothiocarbonyl,                    di( $C_1$ - $C_4)$ alkylaminothiocarbonyl,                    ( $C_1$ -  
 $C_4)$ haloalkylaminothiocarbonyl,

hoặc là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl, thiazolyl, oxazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrolyl, cyclopentenyl hoặc cyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phần tử thê tùy ý là như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxyl, amino, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkyl-( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkyl, halo( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkyl, xyano( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )xyanoalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )hydroxyalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkoxy-( $C_1$ - $C_2$ )alkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkoxy, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkoxy, ( $C_1$ - $C_4$ )alkoxy-( $C_1$ - $C_2$ )alkoxy, ( $C_1$ - $C_4$ )alkoxyimino, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylthio, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylthio, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylsulfinyl, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylsulfinyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylsulfonyl, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylsulfonyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylcarbonyl, aminocarbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylaminocarbonyl, di( $C_1$ - $C_4$ )alkylaminocarbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylaminocarbonyl, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkylaminocarbonyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylsulfonylamino, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylamino, di( $C_1$ - $C_4$ )alkylamino, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylamino, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkylamino, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylcarbonylamino, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkylcarbonylamino, ( $C_1$ - $C_4$ )alkylcarbonyl-( $C_1$ - $C_2$ )alkylamino, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkylcarbonylamino, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkylcarbonyl-( $C_1$ - $C_2$ )alkylamino,

hoặc là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thê một lần hoặc nhiều lần bằng các phần tử thê giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử - trong đó các phần tử thê tùy ý là như sau: xyano, halogen, nitro, hydroxyl, amino, ( $C_3$ - $C_6$ )cycloalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkyl, ( $C_1$ - $C_4$ )alkoxy, ( $C_1$ - $C_4$ )haloalkoxy, aminocarbonyl,

X        là Q1, Q4, Q5, Q7, Q8, Q9, Q11 hoặc Q12,

$R^4$       là methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymethyl hoặc methoxyethyl,

$R^5$       là flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, hoặc pentafoetyl,

$R^6$       là hydro, và

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

$R^1$  là etyl hoặc isopropyl,

$R^2$  là methyl, etyl hoặc isopropyl,

$R^3$  là hydro, brom, xyano, etenyl, cyclopropyletenyl, isopropenyl, cyclopropyletnyl, methyl, etyl, isopropyl, cyclopropyletyl, metoxycarbonyl, trifloetylaminocarbonyl, aminocarbonyl, methylaminocarbonyl, dimethylaminocarbonyl, etylaminocarbonyl, aminothiocarbonyl, methylaminothiocarbonyl, dimethylaminothiocarbonyl,

hoặc là phenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazinyl, thiophenyl (thienyl), thiazolyl, imidazolyl, pyrazolyl, pyrolyl hoặc cyclohexenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần, hai lần hoặc ba lần bằng các phần tử giống nhau hoặc khác nhau - được bắc cầu thông qua nguyên tử cacbon với phần còn lại của phân tử - trong đó các phân tử thế tùy ý là như sau: xyano, flo, clo, methyl, cyclopropyl, xyanomethyl, xyanoisopropyl, xyanocyclopropyl, triflomethyl, trifloetyl, aminocarbonyl,

hoặc là pyrazolyl hoặc imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế một lần bằng clo - được bắc cầu thông qua nguyên tử nitơ với phần còn lại của phân tử,

X là Q1, Q7, Q8, Q9 hoặc Q12,

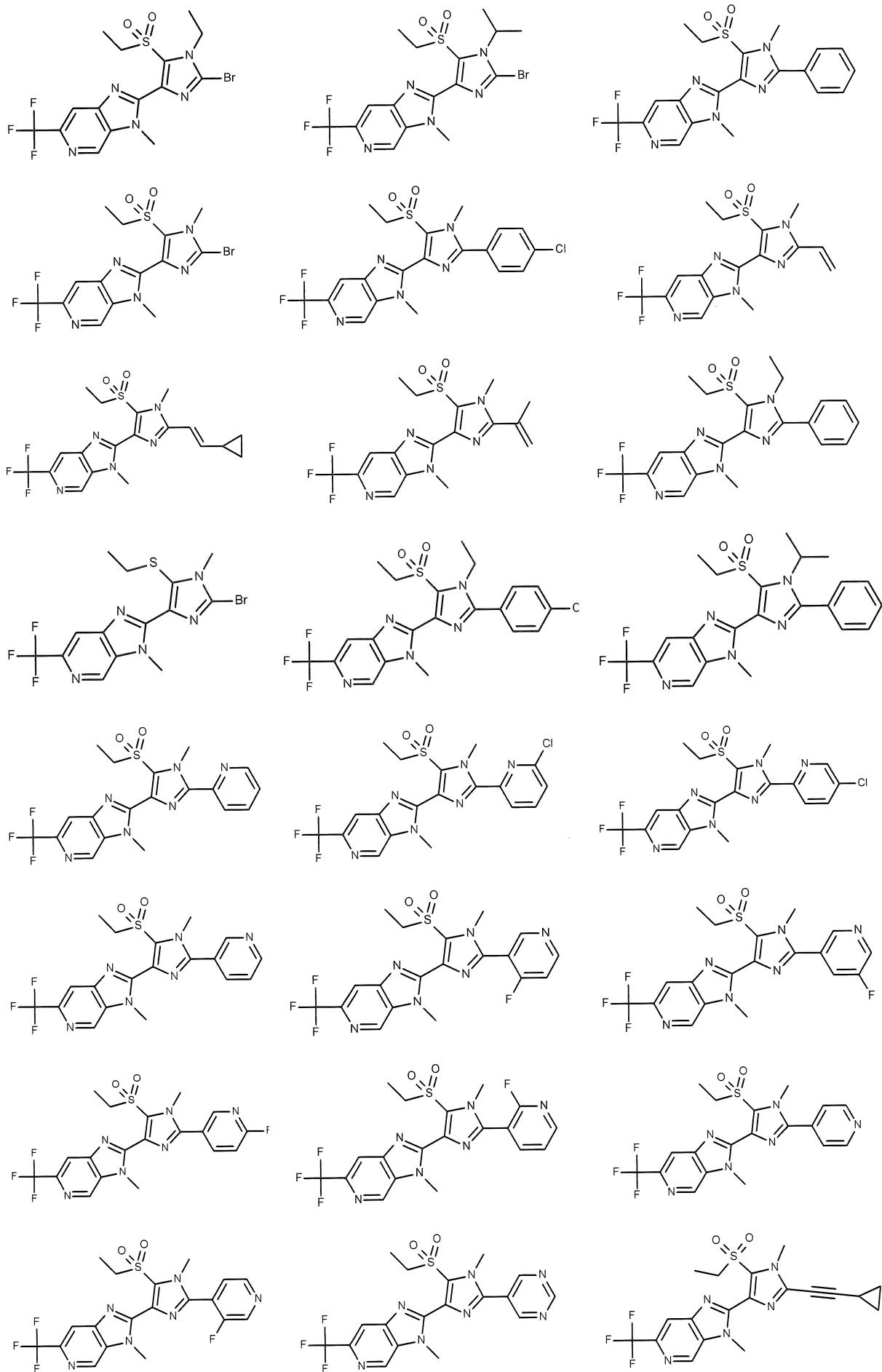
$R^4$  là methyl,

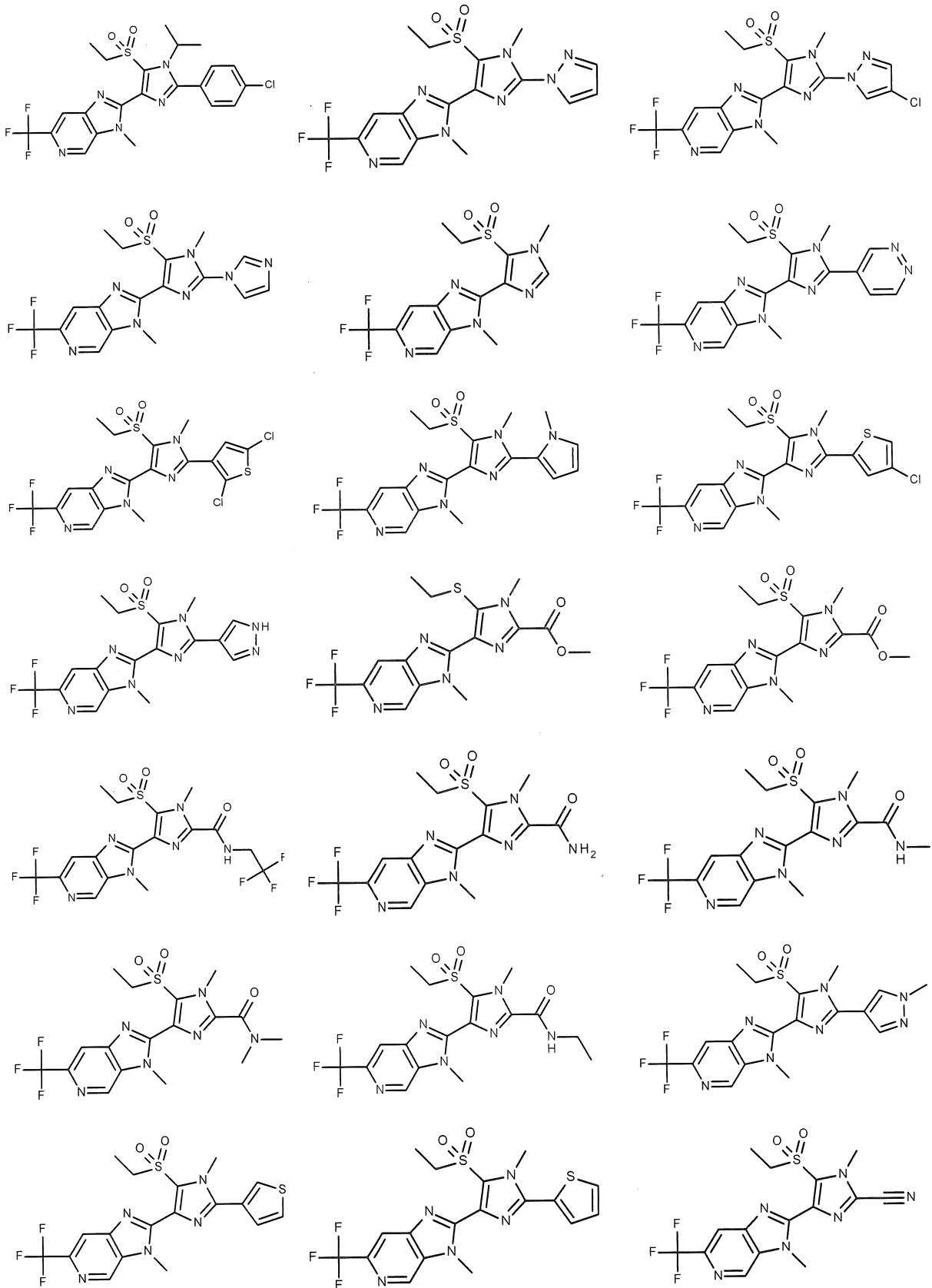
$R^5$  là triflomethyl,

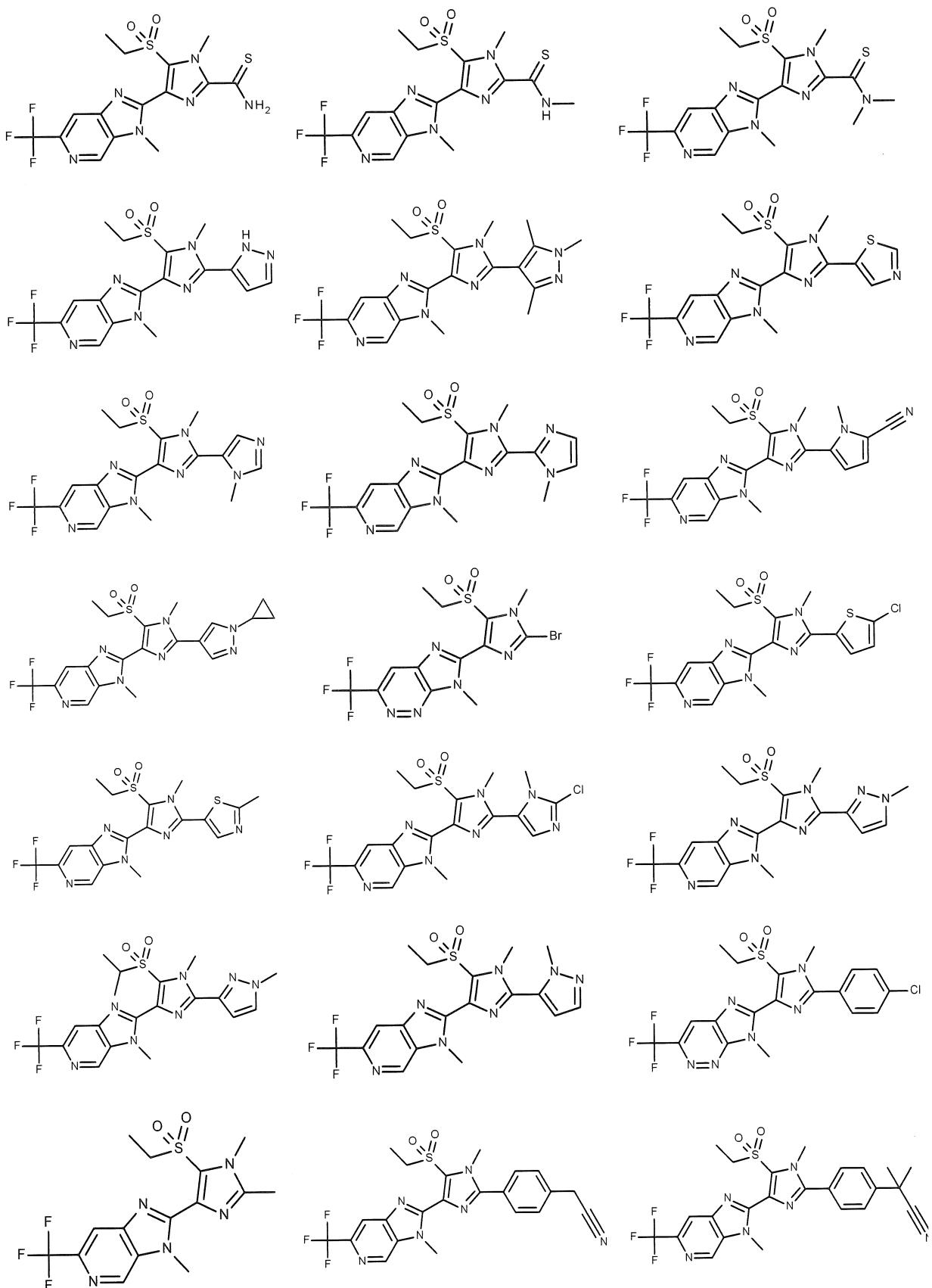
$R^6$  là hydro, và

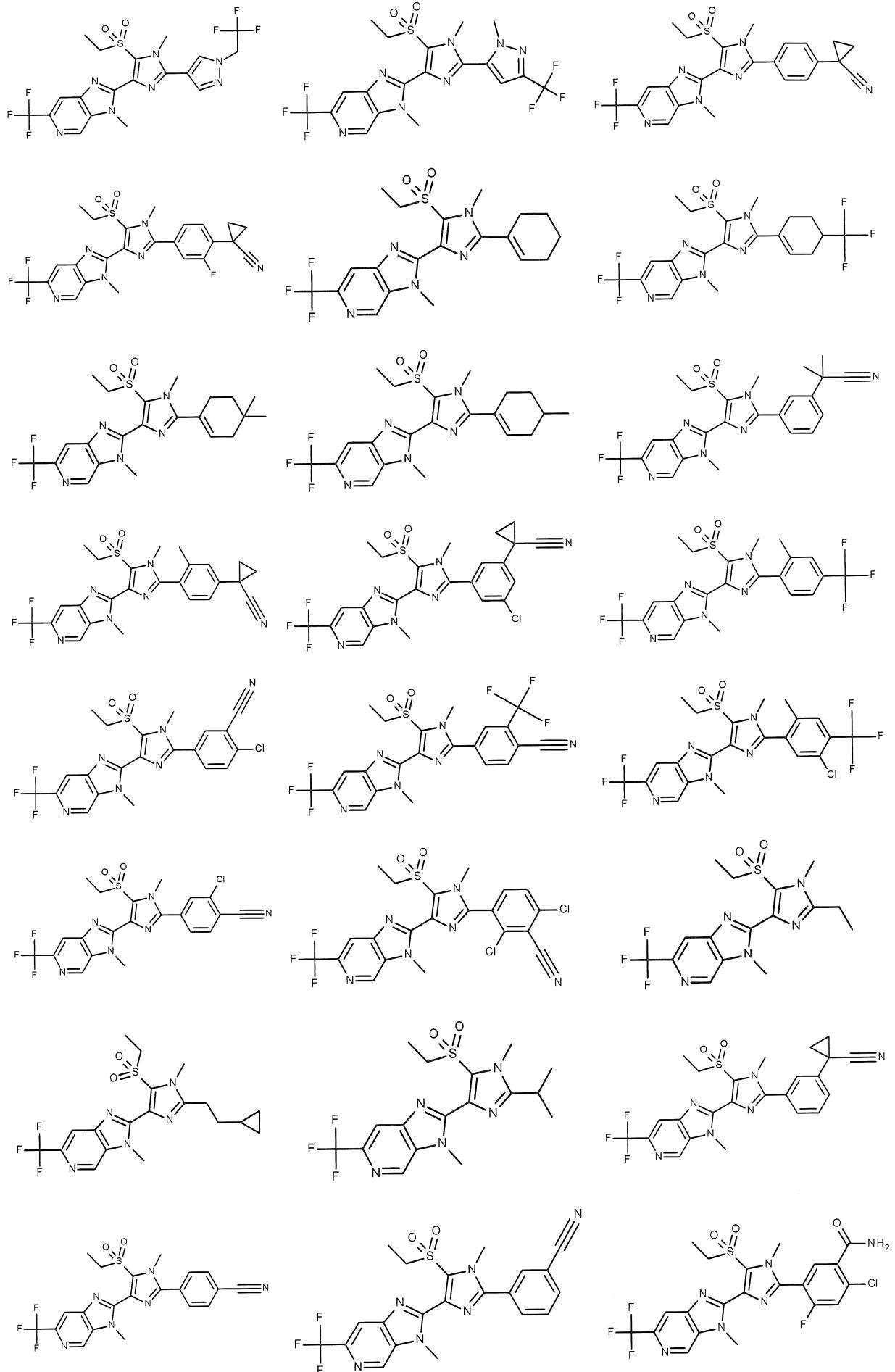
n bằng 0 hoặc 2.

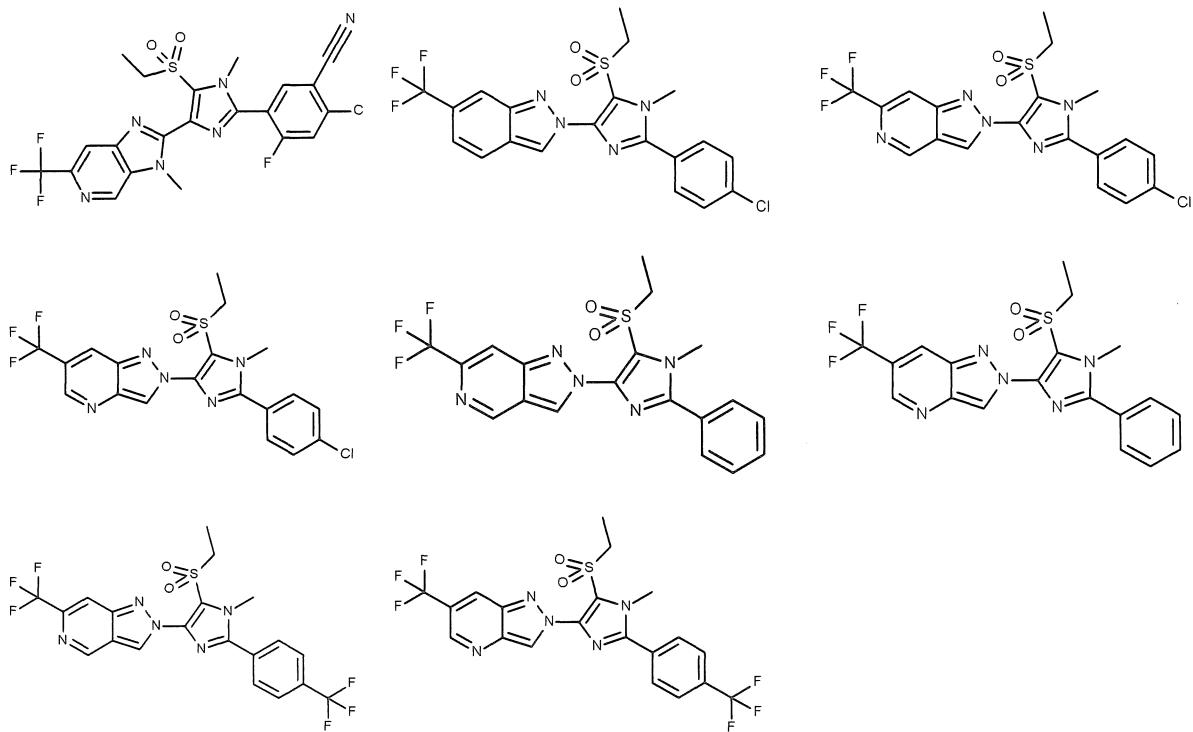
6. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, có các cấu trúc sau:











7. Chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và một hoặc nhiều chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt.
8. Chế phẩm hóa nông theo điểm 7, trong đó chế phẩm này còn chứa thành phần có hoạt tính hóa nông khác.
9. Phương pháp phòng trừ một hoặc nhiều động vật gây hại, bao gồm việc cho hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông của nó tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng.
10. Sản phẩm chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông của nó để phòng trừ một hoặc nhiều động vật gây hại.
11. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 5, trong đó X là Q1.
12. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 5, trong đó X là Q7.
13. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 5, trong đó X là Q8.
14. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 5, trong đó X là Q9.
15. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 5, trong đó X là Q12.