



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẢNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ

(11)



1-0036978

(51)⁷ C07D 403/04; A01N 43/54

(13) B

(21) 1-2019-03996

(22) 03/01/2018

(86) PCT/EP2018/050102 03/01/2018

(87) WO2018/130437 19/07/2018

(30) 17150791.6 10/01/2017 EP

(45) 25/09/2023 426

(43) 25/10/2019 379A

(73) 1. BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany

2. BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

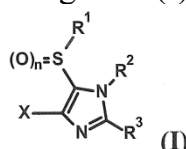
Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim am Rhein, Germany

(72) WILCKE, David (DE); FISCHER, Rüdiger (DE); HAGER, Dominik (DE);
HOFFMEISTER, Laura (DE); KAUSCH-BUSIES, Nina (DE); MOSRIN, Marc
(FR); WILLOT, Matthieu (FR); 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 CHỨA CHÚNG VÀ PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ ĐỘNG
VẬT GÂY HẠI

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



trong đó X, R¹, R², R³ và n có các định nghĩa được nêu trên đây, chế phẩm hóa nông chứa chúng, phương pháp phòng trừ động vật gây hại và các quy trình và hợp chất trung gian để điều chế các hợp chất này.

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 chứa 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 quy trình 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 các tài liệu 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.

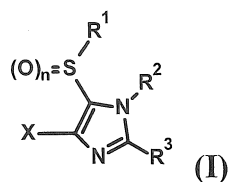
Các chế phẩm bảo vệ cây trồng hiện đại cần phải đáp ứng nhiều yêu cầu, ví dụ, liên quan đến phạm vi, độ tồn dư và phổ tác dụng và mục đích sử dụng có thể của chúng. Các vấn đề về độc tính, bảo tồn các loài có lợi và thực vật thụ phấn, các đặc tính môi trường, tỷ lệ áp dụng, khả năng tương thích với các thành phần hoạt tính khác hoặc các chất phụ gia 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 đề 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 chất khác để cải thiện hiệu lực, đặc biệt là hiệu lực chống lại các côn trùng mà khó phòng trừ.

Do đó, sáng chế đề xuất các hợp chất có công thức (I)



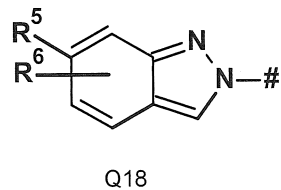
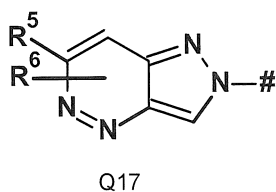
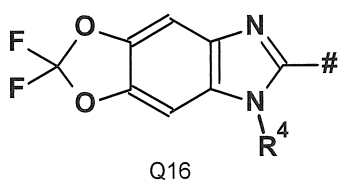
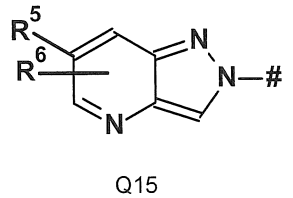
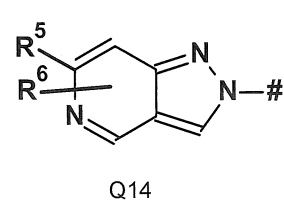
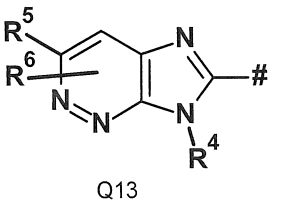
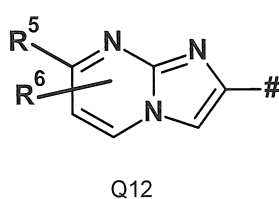
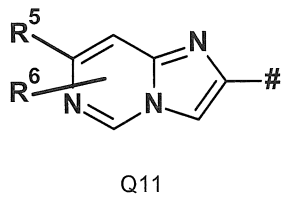
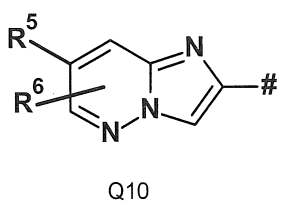
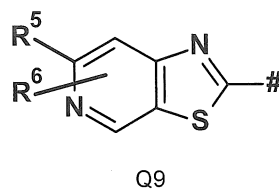
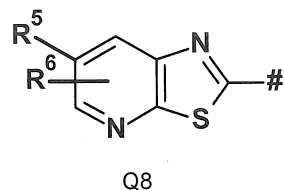
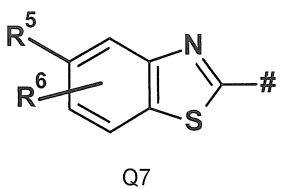
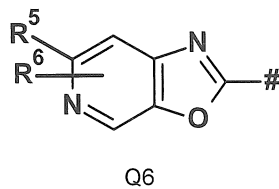
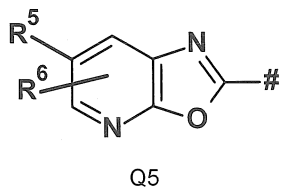
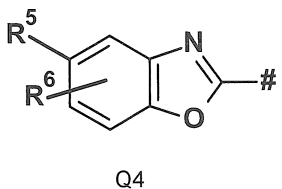
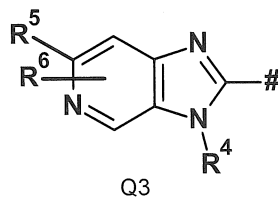
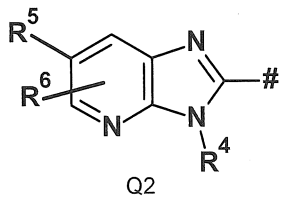
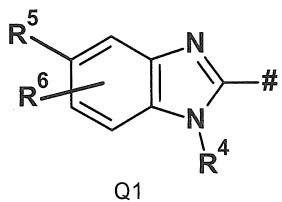
trong đó (cấu hình 1)

R¹ là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl hoặc (C₃-C₈)xycloalkyl,

R² là hydro, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, xyano(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl hoặc (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl,

R³ là (C₃-C₈)xycloalkyl tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, halogen hoặc xyano,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh ngưng tụ có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q18



R⁴ là hydro, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl hoặc (C₃-C₈)xycloalkyl,

R⁵, R⁶ độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, xyano-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl hoặc di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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, nói chung còn có khả năng tương hợp rất tốt với thực vật, đặc biệt là với cây trồng.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các hợp chất theo sáng chế được xác định theo thuật ngữ chung bằng công thức (I). Các phần tử thể 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:

Cấu hình 2

R¹ tốt hơn nếu là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R² tốt hơn nếu là hydro, (C₁-C₈)alkyl, (C₁-C₈)haloalkyl, (C₁-C₈)xyanoalkyl, (C₁-C₈)hydroxyalkyl, (C₁-C₈)alkoxy-(C₁-C₈)alkyl, (C₁-C₈)haloalkoxy-(C₁-C₈)alkyl,

- (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl,
- R³ tốt hơn nếu là (C₃-C₆)xycloalkyl tùy ý được thể một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể có thể trong mỗi trường hợp là: (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, halogen hoặc xyano,
- X tốt hơn nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh ngưng tụ có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q18,
- R⁴ tốt hơn nếu là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- R⁵, R⁶ tốt hơn nếu độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,
- n tốt hơn nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 3

- R¹ tốt hơn nữa nếu là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- R² tốt hơn nữa nếu là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl hoặc halo(C₃-C₆)xycloalkyl,
- R³ tốt hơn nữa nếu là (C₃-C₆)xycloalkyl tùy ý được thể một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể có thể trong mỗi trường

hợp là: (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, halogen hoặc xyano,

- X tốt hơn nữa nếu là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17 hoặc Q18,
- R⁴ tốt hơn nữa nếu là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- R⁵ tốt hơn nữa nếu là halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,
- R⁶ tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- n tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 4

- R¹ thậm chí tốt hơn nữa nếu là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,
- R² thậm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,
- R³ thậm chí tốt hơn nữa nếu là xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl tùy ý được thế một lần hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, xyclopropyl, diflometyl, triflometyl, xyano, flo hoặc clo,
- X thậm chí tốt hơn nữa nếu là Q1, Q2, Q3, Q10, Q11, Q13, Q14, Q15 hoặc Q17,

- R⁴ thậm chí tốt hơn nữa nếu là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,
- R⁵ thậm chí tốt hơn nữa nếu là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,
- R⁶ thậm chí tốt hơn nữa nếu là hydro, xyano, metyl, triflometyl, flo hoặc clo,
- n thậm chí tốt hơn nữa nếu bằng 0, 1 hoặc 2.

Cấu hình 5-1

- R¹ cụ thể là etyl,
- R² cụ thể là metyl,
- R³ cụ thể là xyclopropyl (không được thế),
- X cụ thể là Q2,
- R⁴ cụ thể là metyl,
- R⁵ cụ thể là triflometyl,
- R⁶ cụ thể là hydro,
- n cụ thể bằng 0 hoặc 2.

Cấu hình 5-2

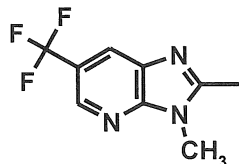
- R¹ cụ thể là etyl,
- R² cụ thể là metyl, etyl hoặc i-propyl,
- R³ cụ thể là xyclopropyl (không được thế) hoặc xyclohexyl tùy ý được thế một lần hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể là: metyl hoặc triflometyl,
- X cụ thể là Q2, Q3, Q13, Q14 hoặc Q15,
- R⁴ cụ thể là metyl,

R⁵ cụ thể là triflometyl, triflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfinyl hoặc triflometylsulfonyl,

R⁶ cụ thể là hydro,

n cụ thể bằng 0 hoặc 2.

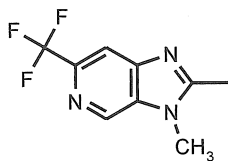
Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong



đó X là

và R¹, R², R³ và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

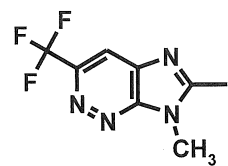
Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong



đó X là

và R¹, R², R³ và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

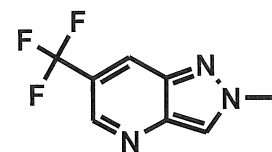
Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong



đó X là

và R¹, R², R³ và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

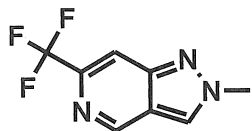
Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong



đó X là

và R¹, R², R³ và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong



đó X là

và R^1 , R^2 , R^3 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2 và R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q3 và R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q13 và R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14 và R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q15 và R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2, Q3, Q13, Q14 hoặc Q15 và R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

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

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

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là xyclohexyl tùy ý được thế một lần hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể là: metyl hoặc triflometyl và X, R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2, R^3 là xyclopropyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^4 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q3, R^3 là xyclopropyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^4 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q3, R^3 là xyclohexyl tùy ý được thế một lần hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể là: metyl hoặc triflometyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^4 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q13, R^3 là xyclopropyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^4 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14, R^3 là xyclopropyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo một phương án được ưu tiên, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q15, R^3 là xyclopropyl, R^6 là hydro và R^1 , R^2 , R^5 và n có các định nghĩa được nêu trong cấu hình (1) hoặc cấu hình (2) hoặc cấu hình (3) hoặc cấu hình (4) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

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 iot, 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 bao gồm phenyl, naphthyl, anthryl, phenanthrenyl, và tốt hơn nếu là phenyl.

Trong phạm vi của sáng chế này, 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 hydrocacbon béo no có 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể phân nhánh hoặc không phân nhánh. Ví dụ về các gốc C₁-C₁₂-alkyl là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodexyl. Trong số các gốc alkyl này, ưu tiên cụ thể đối với các gốc C₁-C₆-alkyl. Ưu tiên đặc biệt đối với các gốc C₁-C₄-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 C₂-C₁₂-alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C₂-C₆-alkenyl và ưu tiên cụ thể đối với các gốc C₂-C₄-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 C₂-C₁₂-alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C₃-C₆-alkynyl và ưu tiên cụ thể đối với các gốc C₃-C₄-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 C₃-C₈-xycloalkyl, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, ưu tiên đối với các gốc C₃-C₆-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 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 iot, đặc biệt là flo, clo hoặc brom.

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

Các định nghĩa hoặc các công thức minh họa của các gốc được đưa ra 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 sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong đó có tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên.

Theo sáng chế, ưu tiên cụ thể là sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong đó có tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên hơn.

Theo sáng chế, ưu tiên rất cụ thể là sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong đó có tổ hợp các định nghĩa được liệt kê trên đây dưới dạng được ưu tiên hơn nữa.

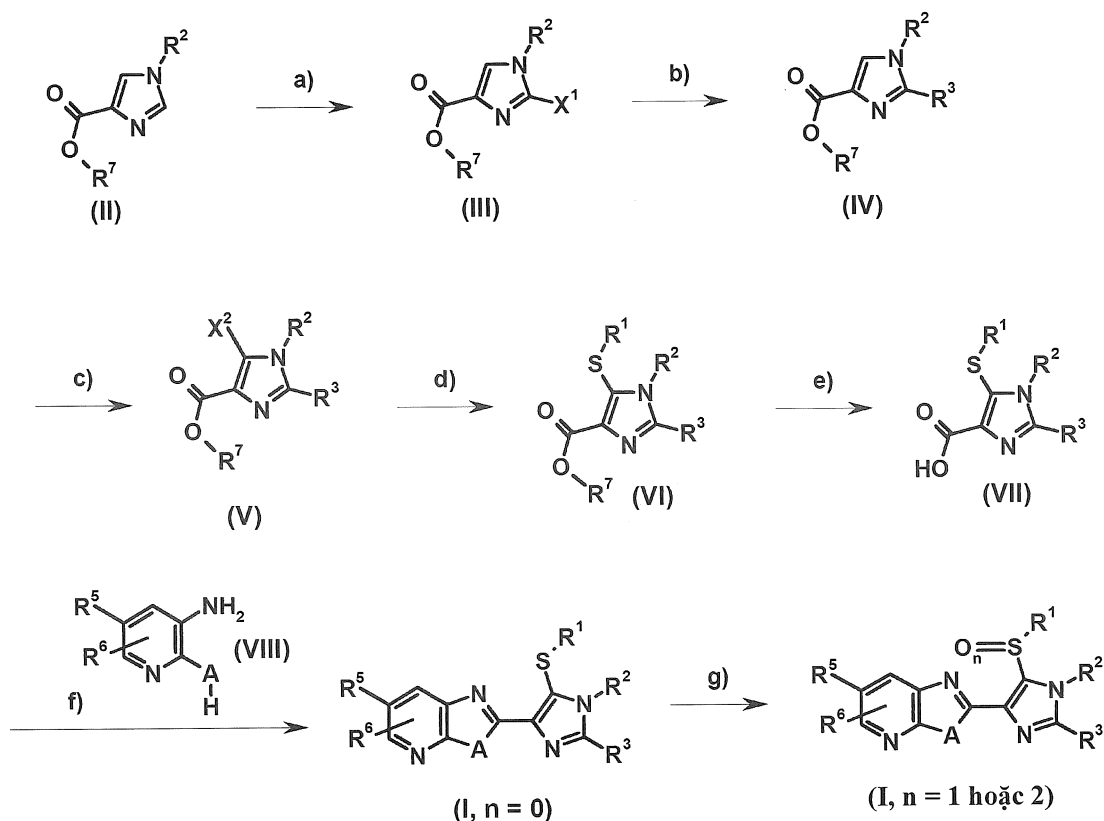
Theo sáng chế, ưu tiên đặc biệt là sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong đó có tổ hợp các định nghĩa được liệt kê dưới dạng các định nghĩa cụ thể.

Tùy thuộc vào bản chất của các phần tử thế, các hợp chất có công thức (I) có thể ở dạng chất đồng phân dị hình 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 dị hình. 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:

Quy trình A

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R³ là xyclopropyl hoặc xyclobutyl – tùy ý được thế như đã được mô tả trên đây – và X là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q13 hoặc Q16 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2, Q5 hoặc Q8.



Các gốc R¹, R², R⁵ và R⁶ có các định nghĩa nêu trên. A là -N-R⁴, O hoặc S, trong đó R⁴ có định nghĩa nêu trên. X¹ và X² là halogen. R⁷ là (C₁-C₄)alkyl. R³ là xyclopropyl hoặc xyclobutyl – tùy ý được thế như nêu trên.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế từ các dẫn xuất imidazol có công thức (II) ví dụ, bằng cách cho phản ứng với chất phản ứng halogen hóa, ví dụ, *N*-bromosuccinimit (NBS), trong dung môi, ví dụ, 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 quy trình 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 quy trình được mô tả trong WO2014/191894, US2003/229079 hoặc WO2013/156608.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (III) trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm bao gồm clo và 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 quy trình được mô tả trong *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2007**, 17, 5825-5830 hoặc US4125726).

Ví dụ, có thể cho các hợp chất có công thức (III) trong đó X^1 tốt hơn là clo hoặc brom phản ứng với các axit boronic [$R^3-B(OH)_2$] 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 bao gồm các muối kim loại chuyển tiếp để thu được các hợp chất có công thức (IV). Các ví dụ được ưu tiên về các chất xúc tác ghép đôi bao gồm 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 để thực hiện các quy trình này tốt hơn là bao gồm các cacbonat của natri, kali hoặc xesi. Một số dẫn xuất của axit boronic [$R^3-B(OH)_2$] hoặc dẫn xuất của 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 phổ biến đã biết (tham khảo *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**). 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 thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ete thường được sử dụng, ví dụ, tetrahydrofuran, dioxan hoặc 1,2-dimetoxyetan.

Bước c)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (V) trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm bao gồm 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*-bromosuccinimit (NBS), (tham khảo WO2009/115572 hoặc WO2010/91411) hoặc *N*-iodosuccinimit (NIS), tùy ý có mặt axit axetic hoặc axit trifloaxetic (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 bao gồm brom hoặc iot có thể được chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (VI), ví dụ, trong điều kiện bazơ bằng cách cho phản ứng với các dẫn xuất mercaptan (R^1-SH) và các muối đồng(I) (tham khảo EP257918 hoặc WO2009/152025) hoặc bằng cách thế 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 bao gồm 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, ví dụ, tris(dibenzylidenacetone)dipaladi [$Pd_2(dba)_3$]. Phản ứng này thường được thực hiện bằng cách sử dụng các bazơ amin, ví dụ, triethylamin hoặc *N,N*-diisopropyletylamin (DIPEA), và các phối tử phosphin, ví dụ, Xantphos (tham khảo WO2013/25958, WO2013/66869, US2009/27039, WO2011/58149, WO2011/143466 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2016**, 26, 2984-2987). Phản ứng này tốt hơn là được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với ete, ví dụ, dioxan hoặc 1,2-dimetoxyetan.

Các dẫn xuất mercaptan, ví dụ, methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan là 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 US2006/25633, US2006/111591, US2820062, *Chemical Communications*, **13** (2000), 1163-1164 hoặc *Journal of the American Chemical Society*, **44** (1922), 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 làm 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 các công thức (VII) bằng các hợp chất có công thức (VIII) với sự có mặt của chất ngưng tụ.

Các hợp chất có công thức (VIII) là 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 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 trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên đối với ete, ví dụ, diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ, diclometan, clorofom, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; rượu như metanol, etanol hoặc isopropanol; nitril, ví dụ, axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ, toluen hoặc xylen; dung môi không proton phân cực, ví dụ, N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ, pyridin.

Ví dụ về các chất ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; anhydrit như anhydrit axetic, anhydrit trifloaxetic; hỗn hợp gồm triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp gồm triphenylphosphin và azo dieste, 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-hydroxybenzotriazol.

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-diisopropyletylamin; bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrua.

Bước g)

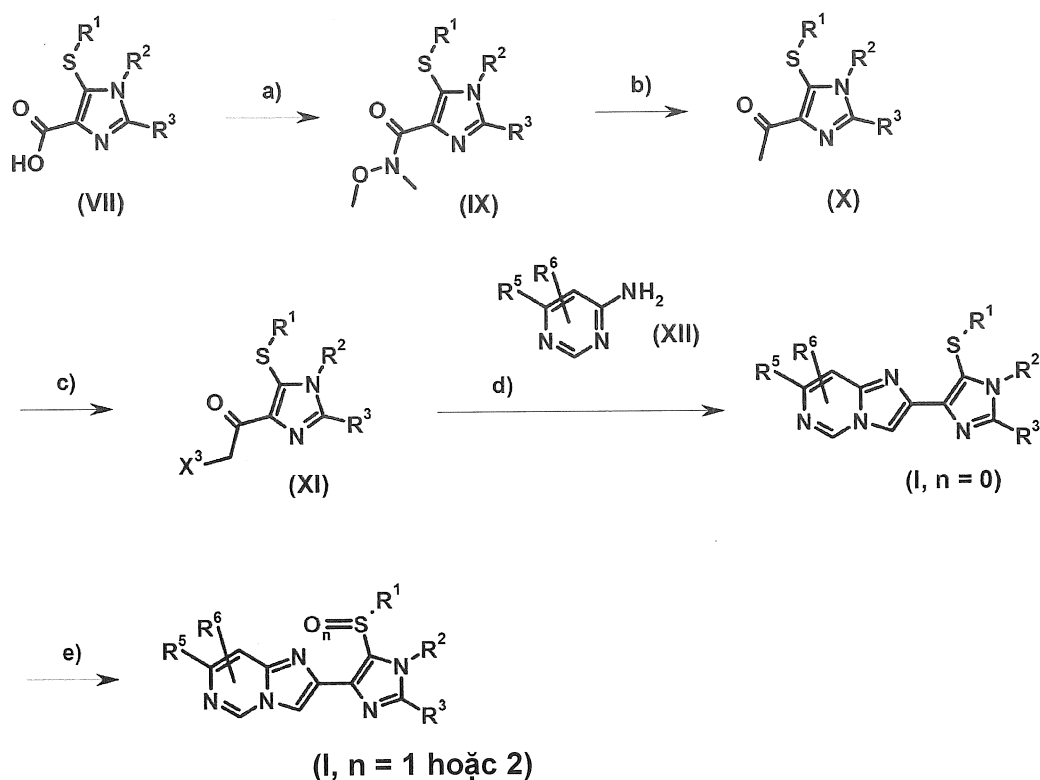
Các hợp chất có công thức (I, $n = 1$ hoặc 2) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I, $n = 0$), ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong WO 2016/169882 hoặc WO 2016/124557. Quá trình oxy hóa nói chung được

thực hiện trong dung môi. Ưu tiên đối với hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ, điclorometan, clorofom, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloroetan hoặc clorobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

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

Quy trình B

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q10, 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 Q11.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 và R^6 có các định nghĩa nêu trên. 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 hydroclorua với sự có mặt của chất ngưng tụ tương tự như các quy trình 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 trợ 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*-dimetylformamit hoặc *N*-metylpyrrolidon.

Ví dụ về các chất ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) và 1,3-dixyclohexylcarbodiimit, 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*-metylmorpholin.

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 metylmagie halogenua, ví dụ, metylmagie bromua, tương tự như các quy trình 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 trợ 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, ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong *Chemistry - A European Journal* **2011**, 17, 4839-4848. Sau đó, enolat được tạo ra có thể được chuyển hóa, ví dụ, bằng trimetylsilyl clorua (TMSCl) thành silyl enol ete, 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 quy trình 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 amin có công thức (XII). Việc đóng vòng này được thực hiện, ví dụ, trong etanol, axetonitril hoặc *N,N*-dimetylformamit 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.

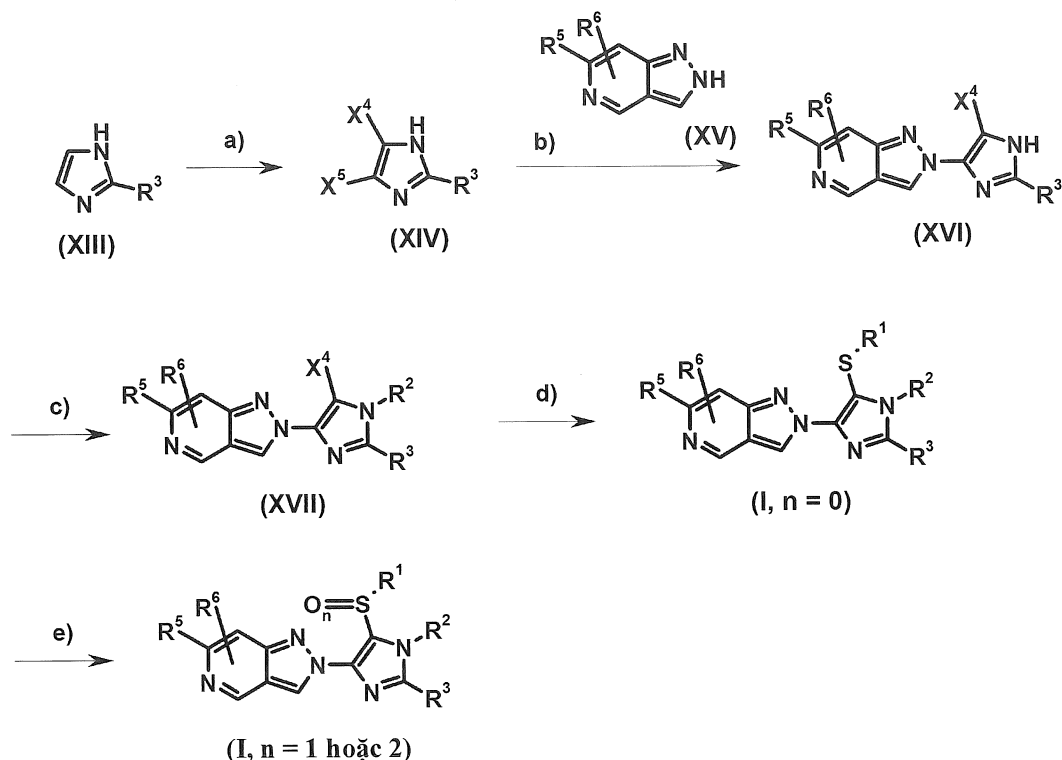
Các hợp chất có công thức (XII) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong US2009/170849, WO2016/51193, WO2016/107742 hoặc WO2016/71214.

Bước e)

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 quy trình A, bước g).

Quy trình C

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14, Q15, Q17 hoặc Q18 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 và R^6 có các định nghĩa nêu trên. X^4 và X^5 là halogen.

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

Bước a)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (XIII) có thể được chuyển hóa tương tự như quy trình A, bước a) và bước c), bằng chất phản ứng halogen hóa, ví dụ, NBS, brom hoặc iot, thành các hợp chất có công thức (XIV) - trong đó X^4 và X^5 tốt hơn là halogen từ nhóm bao gồm brom và 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 quy trình 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, ví dụ, *N,N*-dimethylformamit, tương tự như các quy trình 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, ví dụ, *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 quy trình 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. Ở đây, ưu tiên sử dụng toluen.

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 quy trình 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 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 hợp chất ái điện tử chứa nhóm rời chuyển (R^2 -LG; LG = clo, brom, iot, O-triflat, O-mesyl) trong các dẫn xuất imidazol được thế ở vị trí *N* có công

thức (XVII), ví dụ, với hydroxit kim loại kiềm làm bazơ, như natri hydroxit hoặc kali hydroxit, trong rượu làm dung môi, ví dụ, ethanol.

Bước d)

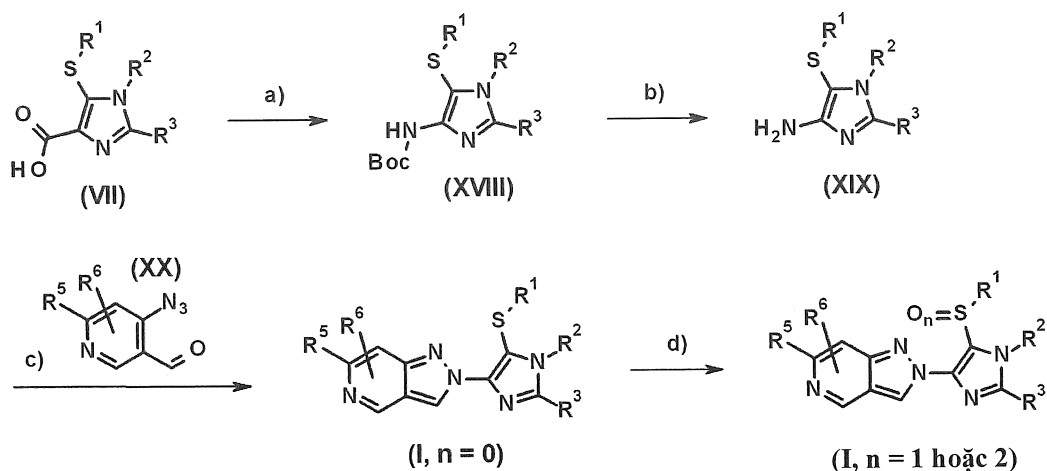
Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XVII) thành các hợp chất có công thức (I, $n=0$) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước d).

Bước e)

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 quy trình A, bước g).

Quy trình D

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14, Q15, Q17 hoặc Q18 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q14.



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 và R^6 có các định nghĩa nêu trên. Boc = *tert*-butoxycarbonyl.

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, ví dụ, triethylamin, ví dụ, tương tự như các quy trình 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, ví dụ, 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, trong toluen hoặc diclometan), tiếp theo đóng vòng với việc sử dụng tùy ý axit, ví dụ, titan tetrachlorua hoặc titan isopropoxit, ví dụ. tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2012/66061 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2017**, 27, 1593 - 1597.

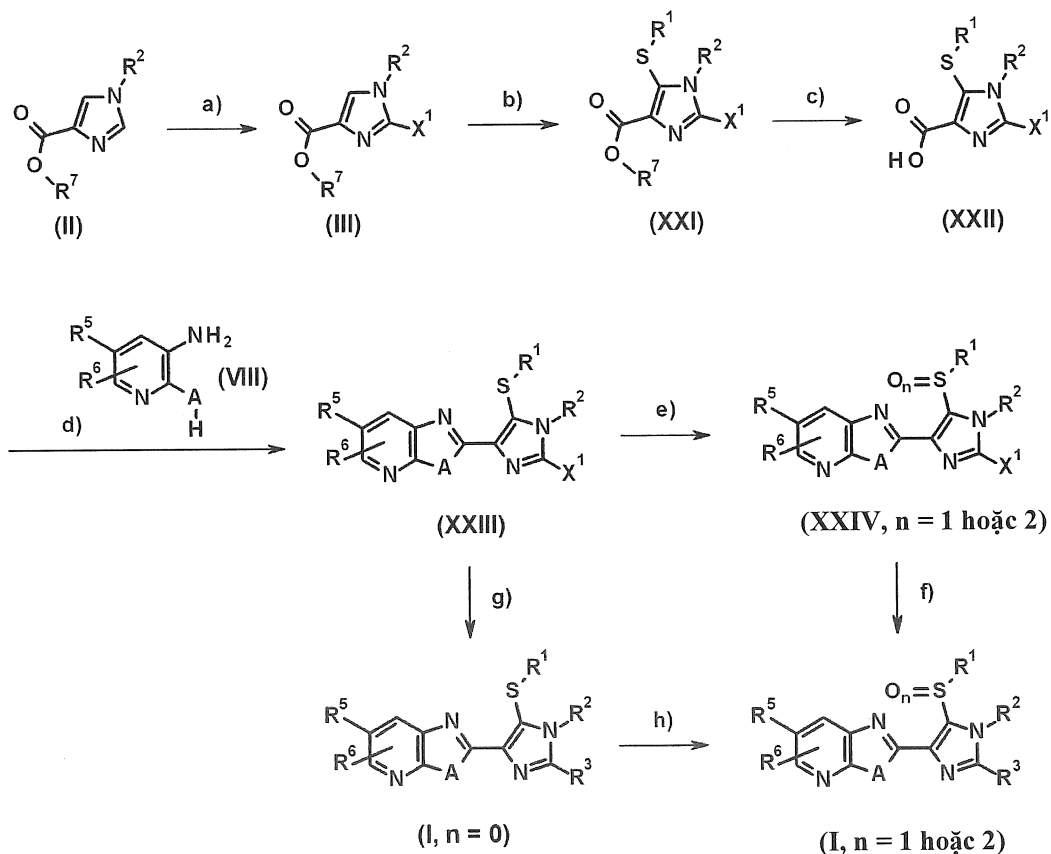
Các hợp chất có công thức (XX) có thể được điều chế tương tự như các quy trình đã biết trong các tài liệu chuyên ngành (xem, ví dụ, WO2015/116882, WO2017/75694, *Angewandte Chemie International Edition* **2011**, 50, 1702-1706 hoặc *Organic Letters* **2010**, 12, 2884-2887).

Bước d)

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 quy trình A, bước g).

Quy trình E

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là xyclopropyl hoặc xyclobutyl – tùy ý được thể như nêu trên – và X là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q13 hoặc Q16 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2, Q5 hoặc Q8.



Các gốc R^1 , R^2 , R^5 và R^6 có các định nghĩa nêu trên. A là $-\text{N}-\text{R}^4$, O hoặc S, trong đó R^4 có định nghĩa nêu trên. X^1 là halogen. R^7 là $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{alkyl}$. R^3 là xyclopropyl hoặc xyclobutyl – tùy ý được thế như nêu trên.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế từ các dẫn xuất imidazol có công thức (II), ví dụ, bằng cách cho phản ứng với chất phản ứng halogen hóa, ví dụ, *N*-bromosuccinimit (NBS), trong dung môi, ví dụ, 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 quy trình 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 quy trình 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)

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XXI) thành các hợp chất có công thức (XXII) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước e).

Bước d)

Phản ứng của các hợp chất có công thức (XXII) với các hợp chất có công thức (VIII) để thu được các hợp chất có công thức (XXIII) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước f).

Bước e,h)

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XXIII) thành các hợp chất có công thức (XXIV) và 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 quy trình A, bước g).

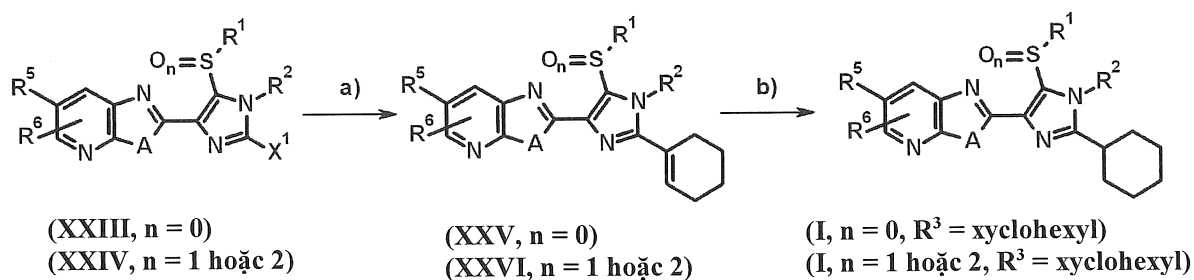
Bước f,g)

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XXIII) thành các hợp chất có công thức (I, $n = 0$) và việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XXIV) thành các hợp chất có công thức (I, $n = 1$ hoặc 2) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước b).

Bắt đầu từ các hợp chất có công thức (XXII), có thể tương tự như quy trình B với việc thực hiện tiếp theo các bước e) $\rightarrow$ f) hoặc g) $\rightarrow$ h) từ quy trình E còn để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q10, Q11 hoặc Q12.

Quy trình F

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là xyclopentyl hoặc xyclohexyl - tùy ý được thể như nêu trên – và X là Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q13 hoặc Q16 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 là xyclohexyl và X là Q2, Q5 hoặc Q8.



Các gốc R¹, R², R⁵ và R⁶ có các định nghĩa nêu trên. A là -N-R⁴, O hoặc S, trong đó R⁴ có định nghĩa nêu trên. X¹ là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXV) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XXIII) và các hợp chất có công thức (XXVI) có thể được điều chế từ các hợp chất có công thức (XXIV), ví dụ, tương tự như quy trình A, bước b), bằng cách sử dụng các axit xyclohexenyl- và xyclopentenylboronic hoặc các este xyclohexenyl- và xyclopentenylboronic thích hợp.

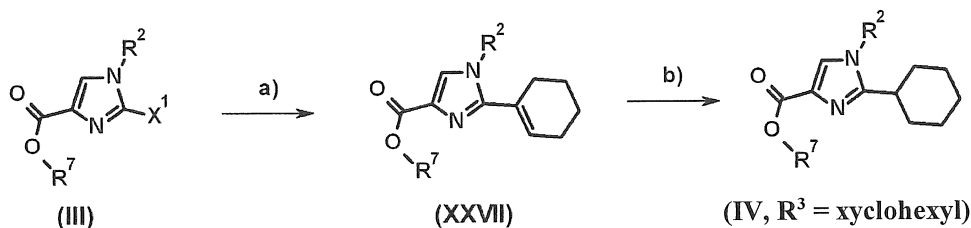
Các axit xyclohexenyl- và xyclopentenylboronic hoặc este xyclohexenyl- và xyclopentenylboronic có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/111056, WO2016/128529 hoặc US2011/166163.

Bước b)

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

Quy trình G

Quy trình chung để điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R³ là xyclopentyl hoặc xyclohexyl - tùy ý được thể như nêu trên –và X là Q10, Q11, Q12, Q14, Q15, Q17 hoặc Q18 được mô tả bằng các ví dụ dưới đây liên quan đến các hợp chất có công thức (I) trong đó R³ là xyclohexyl.



Gốc R² có các định nghĩa nêu trên. X¹ là halogen. R⁷ là (C₁-C₄)alkyl.

Bước a)

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (III) thành các hợp chất có công thức (XXVII) được thực hiện tương tự như quy trình F, bước a).

Bước b)

Việc chuyển hóa các hợp chất có công thức (XXVII) thành các hợp chất có công thức (IV) được thực hiện tương tự như quy trình F, bước b).

Việc chuyển hóa tiếp các hợp chất có công thức (IV) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như các quy trình A, B và D.

Các phương pháp và sử dụng

Sáng chế cũng đề cập đến 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 lĩnh 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 nhậy và kháng thuốc thông

thường và cũng chống 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), đặc biệt là 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., *Amphitetranynchus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., ví dụ, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., ví dụ, *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., ví dụ, *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., ví dụ, *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., ví dụ, *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., ví dụ, *Oligonychus 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), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., ví dụ, *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., ví dụ, *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestani*, *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 dụ, *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., ví dụ, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., ví dụ, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ, *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ, *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ, *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ, *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealundica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ, *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp., ví dụ, *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dụ, *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 dụ, *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ, *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ, *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ, *Leucoptera coffeella*, *Limonius ectypus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megacyllene* spp., ví dụ, *Megacyllene robiniae*, *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ, *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ, *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., ví dụ, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon*

cochleariae, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dụ, *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dụ, *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *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*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ, *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ, *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ, *Zabrus tenebrioides*;

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

thuộc bộ Hai cánh (*Diptera*), ví dụ, *Aedes* spp., ví dụ, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ, *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ, *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysosona 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 betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia*

spp., *Piophila casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ, *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ, *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ, *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ Cánh nửa (Hemiptera), ví dụ, *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ, *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ, *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ, *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ, *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederæ*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ, *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., ví dụ, *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulnia* 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 dụ, *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., ví dụ, *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., ví dụ, *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., ví dụ, *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., ví dụ, *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., ví dụ, *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., ví dụ, *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., ví dụ,

Macrosiphum euphorbiae, *Macrosiphum lili*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., ví dụ, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., ví dụ, *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., ví dụ, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., ví dụ, *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., ví dụ, *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., ví dụ, *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., ví dụ, *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., ví dụ, *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., ví dụ, *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., ví dụ, *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., ví dụ, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., ví dụ, *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., ví dụ, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., ví dụ, *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

thuộc phân bộ Cánh 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., *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa* spp., *Leptocorisa 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* (*Iridiomyrmex*) *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 bằng (Isoptera), ví dụ, *Coptotermes* spp., ví dụ, *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Kaloterme* spp., *Microtermes obesi*, *Nasutitermes* spp., *Odontotermes* spp., *Porotermes* spp., *Reticulitermes* spp., ví dụ, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

thuộc bộ Cánh vảy (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 gemmatilis*, *Argyroproctis* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ, *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca 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*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ, *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

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

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

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

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

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

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

các sinh vật 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 tuyến trùng ký sinh trên thực vật, cụ thể là *Aglenchus* spp., ví dụ, *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., ví dụ, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., ví dụ, *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., ví dụ, *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., ví dụ, *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., ví dụ, *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., ví dụ, *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., ví dụ, *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., ví dụ, *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., ví dụ, *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., ví dụ, *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., ví dụ,

Heterodera avenae, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., ví dụ, *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., ví dụ, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paralongidorus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., ví dụ, *Paratrichodorus minor*, *Paratylenchus* spp., *Pratylenchus* spp., ví dụ, *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., ví dụ, *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., ví dụ, *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., ví dụ, *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., ví dụ, *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., ví dụ, *Xiphinema index*.

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 chất 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 virus (bao gồm chất chống viroít) hoặc làm chất 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 hoạt chất 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, metyl este của dầu hạt cải hoặc metyl 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, glyxerol 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 hoạt chất 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, chất 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 ngữ cảnh 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 chất mà thúc đẩy sự lưu giữ, sự phân tán, sự bám dính vào bề mặt lá hoặc sự xuyên thấu.

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 ứng 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 hydrocacbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), rượu và rượu polyhydric (mà, nếu thích hợp, cũng có thể được thế, 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 thế, 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 alkylnaphtalen, 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, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit 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 alkylnaphtalen, 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, metyl etyl xeton, metyl 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 phấn, thạch anh, attapulgit, montmorillonit 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 đẩy 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 chất thấm ướt 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 thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulfosuccinic, 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 lignosulfít và metylxenluloza. 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 phtaloxyanin kim loại, và chất dinh dưỡng và vi chất dinh dưỡng như các muối của sắt, mangan, bo, đồng, coban, molybden 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 chất 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 carboxymetylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gôm arabic, rượu polyvinyl 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 càn hóa, chất 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 bảo chế.

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 sulfosuccinat, hoặc làm tăng tính nhớt đàn hồi, ví dụ, polyme hydroxypropylguar.

Các chất xuyên thấm hữu ích trong ngữ cảnh của sáng chế là tất cả các chất mà thường được sử dụng để cải thiện tính xuyên thấm của các hoạt chất hóa nông vào trong thực vật. Chất xuyên thấm được xác định trong ngữ cảnh 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 hoạt chất 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, metyl este của dầu hạt cải hoặc metyl 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% khối lượng, tốt hơn nữa là chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,01% đến 95% khối lượng, tốt nhất là chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 90% khối lượng, tính theo khối 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% khối lượng là hợp chất có công thức (I), tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,00001% đến 1% khối lượng, tính theo khối 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 nhuễn 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 bổ 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 đẩy ngược hoặc ngăn chặn sự phát triển tính kháng. Ngoài ra, các tổ hợp hoạt chất 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 hoạt chất 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 đồng phân 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 hoạt chất 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 axetylcholinesteraza (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, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc phosphat hữu cơ, ví dụ, acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, 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, triclofon và vamidothion.

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

(3) Các chất điều biến kênh natri, ví dụ pyrethroit, 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, fenpropathrin, 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, imidacloprid, 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 fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các chất ức chế không đặc hiệu đa dạng (nhiều vị trí), ví dụ, các alkyl halogenua, ví dụ, metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc chloropicrin hoặc sulfuryl florua hoặc chất gây nôn borac hoặc tartar hoặc chất tạo metyl 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 giữa 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, Cry34 Ab1/35Ab1; hoặc
- (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 hydroclorua, 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, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad hoặc rotenon (Derris).

(22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế, ví dụ, indoxacarb hoặc metaflumizon.

(23) Các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, ví dụ, các dẫn xuất của axit tetronic và tetramic, ví dụ, spiroadiclofen, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất ức chế 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 ức chế 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 hoạt chất khác, ví dụ afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclothiaz, benzoximate, bifenazat, broflanilit, bromopropylat, chinomethionat, chloroprallethrin, cryolit, xyclaniliprol, cycloxaprid, cyhalodiamit, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoquin, fluazaindolizin, fluensulfon, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprol, fluhexafon, fluopyram, fluralaner, fluxametamide, fufenozide, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodione, kappa bifenthrin, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spiroadiclofen, tetrametylfluthrin, tetraniliprol, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim và iodometan; ngoài ra, các chế 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-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-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-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl etylcarbonat (đã biết trong tài liệu EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpiiperidin-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-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafloretyl)-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-metyl-6-(metylcarbamoil)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã biết 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 biết 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 biết 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 biết trong tài liệu CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-clo-2-metyl-6-[(metylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit, (Liudaibenjiaxuanan, đã biết 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 biết trong tài liệu WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết 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-metoxi-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biết 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 biết 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 xyclopropanocarboxylic (đã biết trong tài liệu CN 103524422

A) (CAS 1542271-46-4); metyl 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 biết 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-pentafluoetoxy)phenyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamat]- α -L-mannopyranoza (đã biết 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 biết 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-[(metylaminocarbonyl]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 hoạt chất 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 "Pesticide Manual" (16th Ed. British Crop Protection Council) hoặc 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 hỗn 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) prothioconazole, (1.019) pyrisoxazole, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazole, (1.022) tetraconazole, (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)xcyclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xcyclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-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-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-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)methanol, (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}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-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-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-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]metyl}-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]metyl}-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]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.060) 5-(alylsulfanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimetyl-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-etyl-N-metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(pentafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-[(diflometyl)sulfanyl]phenoxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.075) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.081) mefentrifluconazole, (1.082) ipfentrifluconazole.

2) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức 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) pen thiopyrad, (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)benzamid, (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-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-

carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.051) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit.

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức 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) trifloxystrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{(E)-1-flo-2-phenylvinyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpen-3-enamiy, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypyridin-2-yl]carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamit, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-

2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimethylpent-3-enamit,
(3.029) metyl {5-[3-(2,4-dimethylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-methylbenzyl}carbammat.

4) Các chất ức chế sự nguyên phân và sự phân chia tế 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-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.013) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.014) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-bromophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.015) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.016) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.017) 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.018) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2,6-diflophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.019) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.020) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-clophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.021) 4-(2-clo-4-flophenyl)-N-(2-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.022) 4-(4-clophenyl)-5-(2,6-diflophenyl)-3,6-dimetylpyridazin, (4.023) N-(2-bromo-6-flophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.024) N-(2-bromophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin, (4.025) N-(4-clo-2,6-diflophenyl)-4-(2-clo-4-flophenyl)-1,3-dimetyl-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 oxyclorea, (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 chế 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-pyrol[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 ức chế sự sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ, (7.001) xyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin 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 ức chế sự sản sinh ATP, ví dụ, (8.001) silthiofam.

9) Các chất ức chế 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 ức chế sự tổng hợp lipid và màng, ví dụ, (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclorua-metyl.

11) Các chất ức chế sự sinh tổng hợp melanin, ví dụ, (11.001) trixylazol, (11.002) 2,2,2-trifloetyl {3-metyl-1-[(4-metylbenzoyl)amino]butan-2-yl}carbamate.

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

13) Các chất ức chế 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) cyprosulfamid, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothiocyamat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomicin, (15.018) natamycin, (15.019) niken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapirolin, (15.023) oxyfenthin, (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) tolnifanide, (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-metyl-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-metyl-3-(triflometyl)-

1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-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-metoxyphephenyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazolin, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl]-3-clophenyl metansulphonat, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl]-3-clophenyl metansulphonat, (15.041) 2-{2-[(7,8-diflo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-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 metansulphonat, (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 metansulphonat, (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 (dạng 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-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metylpyridin-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-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metylpyridin-2-yl}carbamat, (15.062) 5-flo-4-imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on.

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học làm thành phần phối 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* phân loài *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.* (*Rotylenchulus reniformis* nematode)-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 virus mà được sử dụng hoặc có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại sinh học là:

virus hạt (granulosis virus - GV) *Adoxophyes orana* (sâu bướm cuốn lá trái cây mùa hè), virus hạt (GV) *Cydia pomonella* (sâu bướm đục trái), virus 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 dễ 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 là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Ví dụ về 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 naphthalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-(4-

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

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả 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, tiểu 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 ớt 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), lên đến 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, thể 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 trần, và các bộ phận của chúng, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng 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, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

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

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen (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, CryIIIB2, 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 virus gây bệnh thực vật, ví dụ, gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (systemic acquired resistance - SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc tố được biểu hiện tương ứng, và còn tăng khả năng chịu của thực vật đối với một số hoạt chất 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 bột, 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 vò, 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 hoạt chất 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 thấm 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 nảy mầm 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 hoạt chất được sử dụng để tạo ra sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm tránh khỏi sự tấn công của các động vật gây hại, mà không gây tổn hại cho chính thực vật này bởi hoạt chất được sử dụng. Cụ thể, các phương pháp xử lý hạt cũng cần phải tính đến các đặc tính diệt côn trùng hoặc diệt giun tròn nội sinh của thực vật chuyển gen kháng hoặc chịu được sinh vật gây hại nhằm để đạt được sự bảo vệ tối ưu cho hạt và thực vật nảy mầm với lượng chất diệt sinh vật gây hại tối thiểu.

Do đó, sáng chế cũng đặc biệt đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm 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 nảy mầm chống lại sự tấn công của các sinh vật gây hại còn bao gồm phương pháp, trong đó hạt được xử lý đồng thời trong một công đoạn hoặc 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.

Tương tự, sáng chế đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) trong xử lý hạt để bảo vệ hạt và thực vật nảy mầm 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 các 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 rắc 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.

Hơn nữa, các hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng kết hợp với các chế phẩm trong lĩnh vực công nghệ truyền tín hiệu, dẫn đến khả năng khu trú tốt hơn của các sinh vật cộng sinh, như chủng vi khuẩn nốt rỗ, 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 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 mì, 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, môi 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 ức bờ 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 hoạt chất 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 thành các chế phẩm xử lý hạt thông thường, như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, 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, chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa, chất chống tạo bọt, chất bảo quản, chất làm đặc thứ cấp, chất bám dính, gibberelin 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.

Chất 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 hoạt chất hóa nông. Tốt hơn nếu sử dụng alkyl naphtalensulfonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphtalensulfonat.

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 hoạt chất 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 hoạt chất hóa nông. Chất chống tạo bọt silicon và magie stearat có thể được ưu tiên sử dụng.

Các chất bảo quản có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt 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 polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza.

Giberelin mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế có thể tốt hơn là giberelin A1, A3 (= axit giberelic), A4 và A7; đặc biệt ưu tiên sử dụng axit giberelic. Các giberelin là đã biết (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 loăng 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 mẻ 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 loăng 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 nhân giống động vật và chăn nuôi động vật ở gia súc, động vật gây giống, động vật trong vườn thú, động vật thí nghiệm, động vật thực nghiệm và động vật nuôi trong gia đình. Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính chống lại tất cả các giai đoạn hoặc các giai đoạn phát triển 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 nếu 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 chăn nuôi động vật kinh tế hơn và đơn giản hơn và động vật có thể có được sức khỏe tốt hơn.

Liên quan đến lĩnh vực sức khỏe động vật, thuật ngữ "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, ức chế sự sinh trưởng của nó, hoặc ức 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;

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 trong lĩnh vực 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. (chỉ 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 Actiniedida (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., *Tetratrichomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.

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

Sarcomastigophora (Rhizopoda) như Entamoebidae, ví dụ, *Entamoeba* spp., Centamoebidae, 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., *Echinozoon* 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).

Ví dụ về giun sán 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., *Diphyllbothrium* spp., *Diplogonoporus* spp., *Ichthyobothrium* spp., *Ligula* spp., *Schistocephalus* spp., *Spirometra* spp.

Thuộc bộ viên diệp (*Cyclophyllida*), ví dụ: *Andrya* spp., *Anoplocephala* spp., *Avitellina* spp., *Bertiella* spp., *Cittotaenia* spp., *Davainea* spp., *Diorchis* spp., *Diplopylidium* spp., *Dipylidium* spp., *Echinococcus* spp., *Echinocotyle* spp., *Echinolepis* spp., *Hydatigera* spp., *Hymenolepis* spp., *Joyeuxiella* spp., *Mesocetoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.

Sán lá: thuộc lớp *Digenea*, ví dụ: *Austroilharzia* 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., *Troglostrongylus* 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., *Parastrongyloides* 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., *Cyclocercus* spp., *Cyclodontostomum* spp., *Cylicocyclus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Cystocaulus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Globocephalus* spp., *Graphidium* spp., *Gyaloccephalus* 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., *Troglostrongylus* spp., *Uncinaria* 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., *Skjrabinema* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Strongyluris* spp., *Syphacia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Wuchereria* spp.

Giun đầu móc: 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 chăn nuôi 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 năm 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 được dụng (ví dụ, chất pha loãng rắn hoặc lỏng), chất phụ trợ được dụng (ví dụ, chất hoạt động bề mặt), đặc biệt là tá dược được dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ được 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 được dụng, đặc biệt là tá dược được 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 đẹt, 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 hoạt chất 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) hoạt chất 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 hoạt chất. Theo đó, khi nhiều hơn hai hoạt chất được sử dụng, tất cả các hoạt chất có thể được phối chế trong cùng một chế phẩm chung hoặc tất cả các hoạt chất có thể được phối chế trong các chế phẩm riêng rẽ; tương tự có thể ở dạng trộn lẫn trong đó một số hoạt chất được phối chế cùng nhau và một số hoạt chất được phối chế riêng rẽ. Các chế phẩm riêng rẽ cho phép áp dụng riêng rẽ hoặc lần lượt các hoạt chất cần quan tâm.

Các hoạt chất 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 hoạt chất làm ví dụ từ nhóm gồm các chất diệt sinh vật ngoại ký sinh như các thành phần phối 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 hoạt chất 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 axetylcholine 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 axetylcholine 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 phức hợp I của ty thể; (25) chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II của ty thể; (20) chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp 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 hoạt chất có cơ chế tác động chưa biết hoặc không đặc hiệu, ví dụ fentrifanil, fenoxacrim, xyclopren, clobenzilat, chlordimeform, flubenzimin, dicyclanil, amidoflumet, quinomethionat, triarathen, clothiazoben, 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-salicylate, trichlorfon, sulprofos, propaphos, sebufos, pyridathion, prothoate, dichlofenthion, demeton-S-methyl sulfone, isazofos, xyanofenphos, dialifos, carbophenothion, autathiofos, aromfenvinfos(-metyl), azinphos(-etyl), chlorpyrifos(-etyl), fosmethilan, iodofenphos, dioxabenzofos, formothion, fonofos, flupyrzofos, fensulfothion, etrimfos;

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

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

các neonicotinoit, ví dụ nithiazine

dicloromezotiaz, triflumezopyrim

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

triprene, epofenonane, diofenolan;

các hợp chất sinh học, hormon hoặc pheromon, ví dụ, các sản phẩm tự nhiên, ví dụ, thuringiensin, codlemone hoặc các thành phần của cây sấu đầu

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

các benzoylure, ví dụ, fluazuron, penfluron,

các dẫn xuất của amidin, ví dụ, chlormebuform, cymiazol, demiditraz

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

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

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;

từ 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 (dAMD), tribendimidin;

thuộc nhóm aminoaxetonitril, ví dụ: monepantel;

thuộc nhóm paraherquamit, ví dụ: paraherquamide, derquantel;

thuộc nhóm salicylanilit, ví dụ: tribromsalan, bromoxanid, brotianid, clioxanid, closantel, niclosamid, oxyclozanid, rafoxanid;

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, lucanthone, hycanthone, hetolin, emetin, diethylcarbamazin, 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 đây:

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

thuộc nhóm polyete ionophore, 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: pyrimethamine;

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

thuộc nhóm thiamin, ví dụ: amprolium;

thuộc nhóm lincosamid, ví dụ: clindamycin;

thuộc nhóm carbanilide, ví dụ: imidocarb;

thuộc nhóm nitrofurán, ví dụ: nifurtimox;

thuộc nhóm quinazolinon alkaloid, ví dụ: halofuginon;

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

thuộc nhóm vaccin 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, virus, giun, sinh vật đơn bào và vi khuẩn, từ ổ chứa (thực vật, động vật, người, v.v.) sang vật chủ. Mầm bệnh có thể được truyền theo 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 virus khác, truyền các loại giun khác;

-Aedes: bệnh sốt vàng, sốt xuất huyết, các rối loạn do virus khác, bệnh giun chỉ;

- Simuliidae: truyền giun, đặc biệt là *Onchocerca volvulus*;

- Psychodidae: truyền bệnh *Leishmania*

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

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

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

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

6) Tích: bệnh do xoắn khuẩn *borrelia* như *Borrelia burgdorferi sensu lato.*, *Borrelia duttoni*, viêm não do tích đốt, sốt Q (*Coxiella burnetii*), bệnh babesia (*Babesia canis canis*), bệnh ehrlichiosis.

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

Ví dụ khác về các vật truyền trong ngữ cảnh của sáng chế 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, chấy 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, sáng chế đề 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 ngữ cảnh này được hiểu có nghĩa là vật liệu vô tri vô giác, như tốt hơn là chất dẻo, chất dính kết, hồ dính, giấy và 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. Các chất diệt côn trùng hoặc 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 hoạt chất khác, làm các chất chống cáu gỉ.

Phòng trừ động vật gây hại trong khu 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, tích 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 hoạt chất 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.

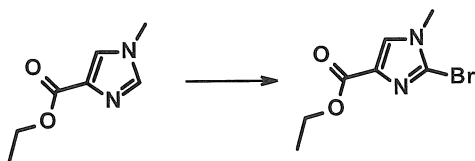
Các sinh vật gây hại này bao gồm, ví dụ, các sinh vật gây hại thuộc lớp Arachnida, thuộc các bộ Scorpiones, Araneae và Opiliones, thuộc các lớp Chilopoda và Diplopoda, thuộc lớp Insecta bộ Blattodea, thuộc các bộ Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera,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

Việc ứng 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 bột, gel, các sản phẩm bay hơi với viên nén bay hơi được làm từ xenluloza hoặc chất dẻo, dụng cụ làm bay hơi chất lỏng, dụng cụ làm bay hơi gel và màng, dụng cụ làm bay hơi được dẫn động bằng cánh quạt, các hệ thống làm bay hơi năng lượng tự do hoặc cưỡng bức, các giấy chống nhậy, túi chống nhậy và gel chống nhậy, ở dạng hạt nhỏ hoặc bụi, trong các môi để phát tán hoặc trong các điểm đặt môi.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế:

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

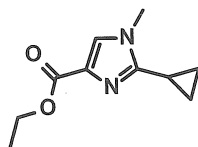


30 g (193,5 mmol) etyl 1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat được hòa tan trong 500 ml

tetrahydrofuran và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C. Bổ sung 34,5 g (193,5 mmol) NBS vào dung dịch này theo từng phần, và hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Phản ứng này được làm kết thúc bằng cách bổ sung dung dịch natri thiosulfat ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$) bão hòa, và 800 ml etyl axetat được bổ sung vào. Các pha được tách ra và việc chiết được thực hiện ba lần bằng 800 ml etyl axetat mỗi lần. Các pha hữu cơ được gộp lại, được 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 với gradien ete dầu mỏ/etyl axetat (3:1) làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(300 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,26 (t, 3H), 3,64 (s, 3H), 4,22 (q, 2H), 8,07 (s, 1H).

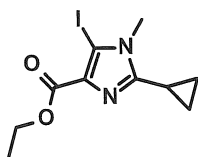
Etyl 2-xyclopropyl-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat



Bổ sung 602 mg (0,85 mmol) bis(triphenylphosphin)paladi(II) diclorua ($\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$), 11,2 g (34,3 mmol) xesi cacbonat và 4,43 g (51,51 mmol) axit xyclopropylboronic vào dung dịch chứa 4 g (17,17 mmol) etyl 2-bromo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat trong tetrahydrofuran (40 ml) và nước (15 ml), và môi trường khí nitơ. Hỗn hợp này được làm nóng đến nhiệt độ 80°C, và 4,43 g (51,51 mmol) nữa axit xyclopropylboronic (được hòa tan trong 20 ml tetrahydrofuran) được bổ sung vào. Hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ 80°C qua đêm. Tiếp theo, hỗn hợp này được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng và được chiết hai lần bằng 200 ml etyl axetat mỗi lần. Các pha hữu cơ được gộp lại, được 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 với gradien ete dầu mỏ/etyl axetat (1:1) làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0,80-0,85 (m, 2H), 0,86-0,93 (m, 2H), 1,23 (t, 3H), 1,93-2,00 (m, 1H), 3,69 (s, 3H), 4,16 (q, 2H), 7,75 (s, 1H).

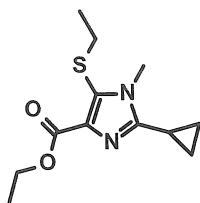
Etyl 2-xyclopropyl-5-iodo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat



Bổ sung 620 mg (3,50 mmol) *N*-iodosuccinimit (NIS) vào dung dịch chứa 350 mg (1,80 mmol) ethyl 2-xyclopropyl-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat trong axit axetic (15 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng này được cô dưới áp suất thấp và dung dịch natri thiosulfat bão hòa được bổ sung vào. Dung dịch này được điều chỉnh đến độ pH = 7-8 bằng cách bổ sung dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa. Sau đó, việc chiết được thực hiện hai lần bằng 50 ml ethyl axetat mỗi lần. Các pha hữu cơ được gộp lại, được làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách sắc ký lớp mỏng điều chế với gradien ete dầu mỏ/ethyl axetat (2:1) làm dung môi rửa giải.

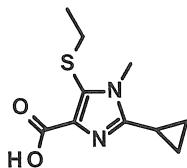
^1H NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0,81-0,84 (m, 2H), 0,91-0,95 (m, 2H), 1,26 (t, 3H), 2,09 (m, 1H), 3,67 (s, 3H), 4,19 (q, 2H).

Ethyl 2-xyclopropyl-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat

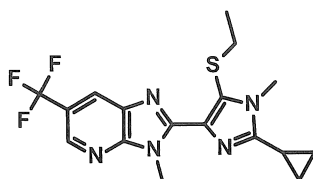


Bổ sung 116 mg (1,88 mmol) etanthiol, 364 mg (2,82 mmol) *N,N*-diisopropyletylamin (DIPEA), 55 mg (0,05 mmol) sản phẩm cộng tris(dibenzylidenaxeton)-dipaladi(0)-clorofom $[\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3]$ và 55 mg (0,1 mmol) Xantphos vào dung dịch chứa 300 mg (0,94 mmol) ethyl 2-xyclopropyl-5-iod-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat trong 1,4-dioxan (15 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 100°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, việc chiết được thực hiện hai lần bằng ethyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, được làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách sắc ký lớp mỏng điều chế với gradien ete dầu mỏ/ethyl axetat (1:1) làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0,82-0,98 (m, 4H), 1,08 (t, 3H), 1,26 (t, 3H), 2,00-2,10 (m, 1H), 2,80 (q, 2H), 3,70 (s, 3H), 4,21 (q, 2H).

Axit 2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic

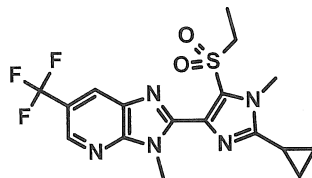
Bổ sung 189 mg (4,70 mmol) natri hydroxit vào dung dịch chứa 240 mg (0,94 mmol) etyl 2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat trong metanol (6 ml) và nước (6 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Dung dịch này được điều chỉnh đến độ pH = 3-4 bằng cách bổ sung nước axit clohydric đặc. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng này được chiết bằng clorofom. Các pha hữu cơ được gộp lại, được làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được sử dụng trong giai đoạn tổng hợp tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (I-1)

Bổ sung 168 mg (0,88 mmol) N²-metyl-5-(triflometyl)pyridin-2,3-diamin và 168 mg (0,88 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) vào dung dịch chứa 200 mg (0,76 mmol) axit 2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic trong pyridin (10 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, nước được bổ sung vào và việc chiết được thực hiện bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, được làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được hòa tan trong axit axetic (15 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 100°C qua đêm và được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng, nước (20 ml) được bổ sung vào và hỗn hợp này được điều chỉnh đến độ pH = 7-8 bằng cách bổ sung dung dịch natri hydrocacbonat bão hòa. Sau đó, hỗn hợp này được chiết hai lần bằng etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Cặn được tinh chế bằng cách sắc ký lớp mỏng điều chế với gradien ete dầu mỏ/etyl axetat (3:1) làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(300 MHz, CDCl_3) δ ppm: 1,00-1,13 (m, 7H), 1,80-1,89 (m, 1H), 2,88 (q, 2H), 3,75 (s, 3H), 4,07 (s, 3H), 8,21 (d, 1H), 8,55 (d, 1H).

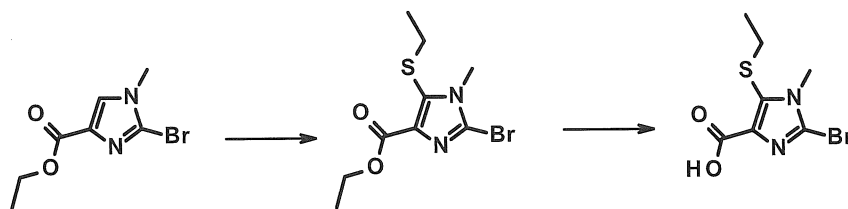
2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (I-2)



Bổ sung 163 mg (0,95 mmol) axit *meta*-cloperbenzoic (*m*CPBA) vào dung dịch chứa 90 mg (0,23 mmol) 2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin trong diclometan (20 ml) ở nhiệt độ 0°C . Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, dung dịch này được pha loãng bằng cách bổ sung diclometan (50 ml) và được rửa bằng dung dịch natri thiosulfat bão hòa. Pha hữu cơ được lấy ra, được làm khô bằng natri sulfat và được lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và cặn được tinh chế bằng cách sắc ký lớp mỏng điều chế với gradien ete dầu mỏ/etyl axetat (1:1) làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(300 MHz, CDCl_3) δ ppm: 1,06-1,14 (m, 4H), 1,35 (t, 3H), 1,82-1,91 (m, 1H), 3,71 (q, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,98 (s, 3H), 8,19 (d, 1H), 8,61 (d, 1H).

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

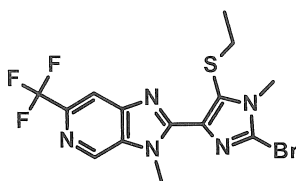


31 g (134 mmol) etyl 2-bromo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat và 24,4 g (200 mmol) dietyl disulfua được hòa tan trong 620 ml tetrahydrofuran và được làm lạnh xuống nhiệt độ -78°C . Bổ sung theo từng giọt 100 ml (2M trong THF, 200 mmol) lithi diisopropylamit (LDA) vào dung dịch này, và hỗn hợp phản ứng này được khuấy ở nhiệt độ -78°C trong 30 phút. Phản ứng này được làm kết thúc bằng cách bổ sung dung dịch amoni clorua bão hòa. Các pha được tách ra và pha nước được chiết ba lần bằng 300 ml etyl axetat mỗi lần. Các pha hữu cơ được gộp lại, được làm khô bằng magie 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 với gradien ete dầu mỏ/etyl axetat làm dung môi rửa giải. Thu được 28,5 g (97,3 mmol) ethyl 2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat. Sản phẩm 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 bổ sung dung dịch HCl 1N. Sau đó, hỗn hợp này được chiết bằng etyl axetat. Dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp và thu được hợp chất đích.

^1H NMR(300 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,09 (t, 3H), 2,86 (q, 2H), 3,64 (s, 3H), 12,60 (s, 1H).

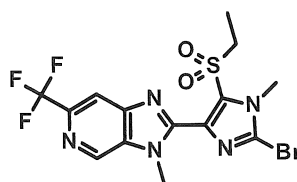
2-[2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin



Bổ sung 5,00 g (26,1 mmol) N^3 -metyl-6-(triflometyl)pyridin-3,4-diamin và 5,01 g (26,1 mmol) 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (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 thấm trong axit axetic (50 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ 100°C trong 6 giờ, được để nguội xuống nhiệt độ trong phòng, tạo huyền phù đặc bằng nước, sau đó, được lọc qua máy lọc hút và làm khô, và từ đó thu được hợp chất đích.

^1H NMR(400 MHz, D_6 -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).

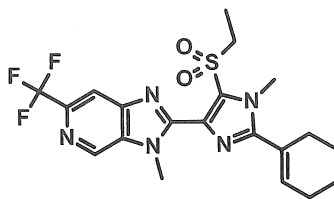
2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin



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-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-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 lấy ra, được làm khô bằng natri sulfat và lọc, và hợp chất đích thu được bằng cách loại bỏ dung môi dưới áp suất thấp.

^1H NMR(400 MHz, D_6 -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).

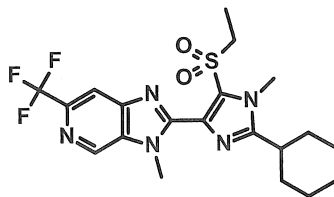
2-[2-(xyclohex-1-en-1-yl)-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin



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, 92,0 mg (0,44 mmol) 2-(xyclohex-1-en-1-yl)-4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan và 15,3 mg (0,01 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi ban đầu được nạp vào trong môi trường khí bảo vệ. Sau đó, 3,5 ml dioxan đã được loại khí và 1,8 ml dung dịch nước 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 thấm trong diclometan và được rửa bằng nước. Pha hữu cơ được lấy ra, làm khô bằng magie sulfat và lọc, và dung môi được chưng cất dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng cách sắc ký cột tinh chế với gradien xyclohexan/axeton làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 1,63-1,78 (m, 4H), 2,25-2,29 (m, 2H), 2,38-2,42 (m, 2H), 3,73 (q, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 6,29-6,31 (m, 1H), 8,22 (s, 1H), 9,20 (s, 1H).

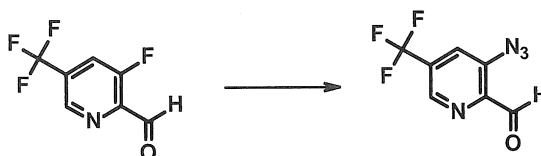
2-[2-xyclohexyl-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin (I-13)



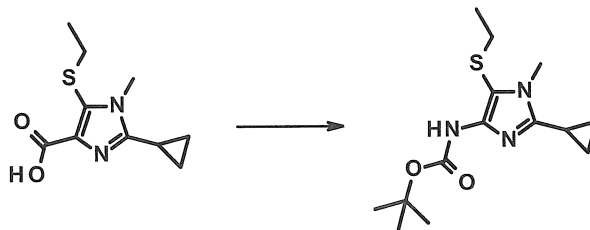
143 mg (0,31 mmol) 2-[2-(xyclohex-1-en-1-yl)-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-c]pyridin ban đầu được nạp trong 20 ml metanol trong nồi hấp. Sau đó, 50 mg (0,04 mmol, 10%) paladi trên than được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy dưới môi trường khí hydro ở áp suất 5 bar (500 kPa) trong 16 giờ. Sau khi áp suất đã được làm cân bằng và môi trường khí hydro đã được loại bỏ, 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 với gradien xyclohexan/axeton làm dung môi rửa giải.

^1H NMR(400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 1,23-1,31 (t + m, 4H), 1,37-1,48 (m, 2H), 1,52-1,62 (m, 2H), 1,69-1,73 (m, 1H), 1,78-1,83 (m, 2H), 1,93-1,96 (m, 2H), 2,95-3,02 (m, 1H), 3,71 (q, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 8,20 (s, 1H), 9,19 (s, 1H).

3-azido-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt

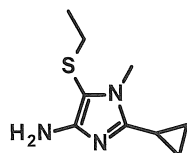


1 g (5,2 mmol) 3-flo-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt ban đầu được nạp trong 10 ml dimetylformamit (DMF) và được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C . Sau đó, 0,34 g (5,2 mmol, đã được hòa tan trong 10 ml DMF) natri azit được bổ sung vào và hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4 giờ. Phản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

***tert*-butyl [2-*x*cyclopropyl-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]carbamate**

Bổ sung 1,3 g (4,72 mmol) diphenyl azidophosphat (DPPA) và 1,5 g (14,8 mmol) triethylamin vào dung dịch chứa 800 mg (3,5 mmol) axit 2-*x*cyclopropyl-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-carboxylic trong *tert*-butanol (20 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 hai lần bằng 150 ml etyl axetat mỗi lần. Pha hữu cơ gộp lại được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulfate và 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 với gradien etyl axetat/ete dầu mỏ (1:3 → 1:1) làm dung môi rửa giải.

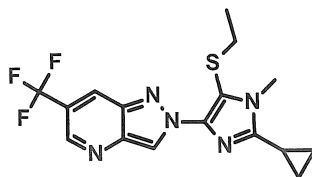
MS (ESI): 298 [(M+H)⁺]

2-*x*cyclopropyl-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-amin

Bổ sung 10 ml axit clohydric đặc vào dung dịch chứa 400 mg (1,3 mmol) *tert*-butyl [2-*x*cyclopropyl-5-(ethylsulfanyl)-1-methyl-1H-imidazol-4-yl]carbamate trong dioxan (10 ml). Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm và sau đó, cô đến khô dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô này được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

MS (ESI): 198 [(M+H)⁺]

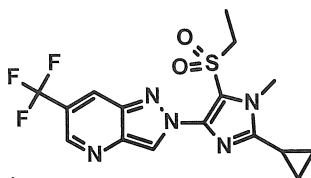
2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin



Bổ sung 280 mg (1,3 mmol) 3-azido-5-(triflometyl)pyridin-2-carbaldehyt và 970 mg (3,4 mmol) titan isopropoxit vào dung dịch chứa 130 mg (0,66 mmol) 2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-amin trong toluen (10 ml). Hỗn hợp này được khuấy đầu tiên ở nhiệt độ 50°C trong 5 giờ và sau đó, ở 100°C trong 1 giờ. Sau khi để nguội xuống nhiệt độ trong phòng, 100 ml nước được bổ sung vào và hỗn hợp này được chiết hai lần bằng 100 ml etyl axetat mỗi lần. Pha hữu cơ gộp lại được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, được làm khô bằng natri sulfat và 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 với gradien etyl axetat/ete dầu mỏ (1:2) làm dung môi rửa giải.

MS (ESI): 368 [(M+H)⁺]

2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin (I-18)



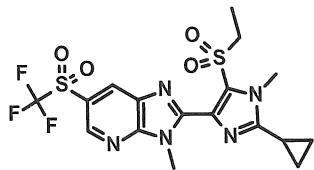
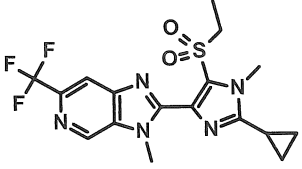
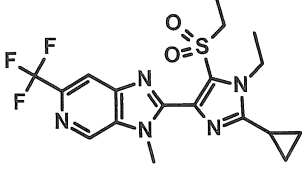
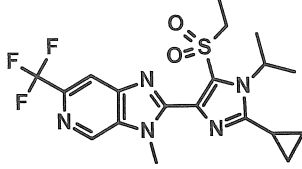
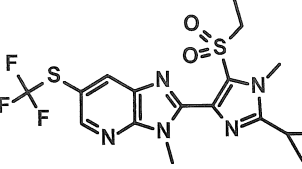
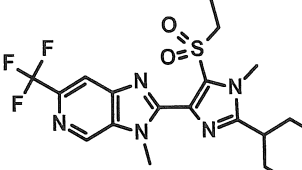
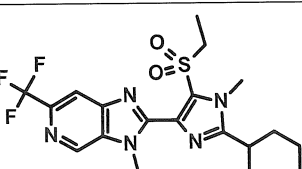
Dung dịch chứa 80 mg (0,22 mmol) 2-[2-xyclopropyl-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-6-(triflometyl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin trong diclometan (10 ml) được làm lạnh xuống nhiệt độ 0°C, và 173 mg (1,5 mmol, 35% trong nước) hydro peroxit và 50 mg (1,1 mmol) axit formic được bổ sung vào. Hỗn hợp này được khuấy ở nhiệt độ trong 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 lấy ra, được làm khô bằng natri sulfat và lọc, và dung môi được loại bỏ dưới áp suất thấp. Sản phẩm thô được tinh chế bằng HPLC điều chế với gradien nước/axetonitril làm dung môi rửa giải.

¹H NMR(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm = 0,99-1,13 (m, 4H), 1,25 (t, 3H), 2,23-2,30

(m, 1H), 3,64 (q, 2H), 3,99 (s, 3H), 8,78 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 9,22 (s, 1H).

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

Ví dụ	Cấu trúc
I-1	
I-2	
I-3	
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	

I-8	
I-9	
I-10	
I-11	
I-12	
I-13	
I-14	

I-15	
I-16	
I-17	
I-18	
I-19	

Lưu ý về việc xác định phát hiện khối lượng: trừ khi có chỉ dẫn khác, khối lượng được báo cáo là pic của kiểu chất đồng vị của ion $[M+H]^+$ có cường độ cao nhất. Khối lượng được phát hiện bằng Shimadzu LCMS-2020.

Dữ liệu NMR của các ví dụ được chọn

Dữ liệu NMR của các ví dụ được chọn được liệt kê ở dạng thông thường (các trị số δ , chia vạch bội, số lượng nguyên tử hydro) hoặc dưới dạng danh sách pic NMR.

Trong mỗi trường hợp, dung môi trong đó phổ NMR đã được ghi lại được chỉ ra.

Phương pháp liệt kê 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_1 (cường độ₁); δ_2 (cường độ₂);.....; δ_i (cường độ_i);.....; δ_n (cường độ_n)

Cường độ của các tín hiệu rõ rệt liên quan đến chiều cao của tín hiệu trong ví dụ in sẵn của phổ 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 phổ.

Sự hiệu chỉnh độ dịch chuyển hóa học của phổ ^1H NMR được thực hiện bằng cách sử dụng tetrametylsilan và/hoặc độ dịch chuyển hóa học của dung môi, đặc biệt là trong trường hợp phổ mà được đo trong DMSO. Do đó, pic tetrametylsilan 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 hợp chất đích, mà tương tự như vậy tạo nên một phần của 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_6 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, trong trường hợp này các pic của chúng có thể giúp xác nhận khả năng lặp 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.

Ví dụ I-1: ^1H-NMR(300,1 MHz, CDCl_3): δ= 8,5508 (2,0); 8,5470 (2,0); 8,2068 (2,2); 8,2017 (2,1); 7,1922 (6,7); 5,2290 (0,4); 4,0675 (16,0); 3,7541 (15,4); 2,9130 (1,2); 2,8884 (3,7); 2,8638 (3,8); 2,8393 (1,3); 1,8709 (0,6); 1,8606 (0,6); 1,8443 (1,0); 1,8327 (0,5); 1,8274 (0,7); 1,8169 (0,7); 1,8001 (0,4); 1,1284 (4,0); 1,1039 (8,0); 1,0793 (4,0); 1,0635 (1,6); 1,0555 (2,0); 1,0467 (2,6); 1,0392 (1,8); 1,0289 (1,1); 1,0116 (1,4); 1,0023 (1,9); 0,9946 (1,4); 0,9854 (1,2); 0,9754 (2,0); 0,9672 (1,2); 0,9496 (0,4); 0,0165 (0,5); 0,0116 (0,7); -0,0001 (12,3); -0,0123 (0,5); -0,0710 (5,9)
Ví dụ I-2: ^1H-NMR(300,1 MHz, CDCl_3): δ= 8,6142 (2,0); 8,6103 (2,0); 8,1922 (2,0); 8,1872 (2,0); 7,1929 (4,1); 5,2280 (0,4); 3,9775 (15,2); 3,8905 (16,0); 3,7395 (1,0); 3,7148 (3,2); 3,6900 (3,3); 3,6653 (1,1); 3,4081 (3,5); 1,8877 (0,5); 1,8791 (0,6); 1,8709 (0,4); 1,8619 (1,1); 1,8507 (0,4); 1,8441 (0,6); 1,8355 (0,6); 1,8179 (0,3); 1,3742 (3,4); 1,3495 (7,2); 1,3247 (3,3); 1,1840 (0,4); 1,1151 (1,0); 1,1070 (2,5); 1,1010 (2,1); 1,0879 (3,8); 1,0668 (1,4); 1,0603 (2,2); 1,0516 (1,2); 1,0301 (0,3); -0,0002 (5,6); -0,0718 (3,5)
Ví dụ I-3: ^1H-NMR(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 8,4328 (2,2); 8,4279 (2,2); 8,3150 (0,5); 8,2014 (2,2); 4,0143 (16,0); 3,9284 (1,1); 3,9077 (1,1); 3,7964 (14,2); 3,3682 (1,3); 3,3279 (129,7); 2,9887 (1,2); 2,9703 (3,9); 2,9519 (3,9); 2,9335 (1,3); 2,8902 (0,4); 2,6706 (2,0); 2,5059 (283,5); 2,5016 (360,4); 2,4974 (270,8); 2,3281 (2,0); 2,3238 (1,6); 2,1991 (0,3); 2,1874 (0,6); 2,1787 (0,7); 2,1665 (1,2); 2,1539 (0,7); 2,1469 (0,6); 2,1342 (0,3); 1,2329 (0,6); 1,1118 (4,1); 1,0934 (8,5); 1,0750 (4,0); 1,0481 (0,6); 1,0359 (1,4); 1,0297 (2,3); 1,0226 (1,4); 1,0151 (1,5); 1,0094 (2,1); 1,0028 (1,4); 0,9878 (1,3); 0,9804 (2,2); 0,9747 (2,9); 0,9685 (2,3); 0,9624 (1,8); 0,9496 (0,6); -0,0002 (56,0)
Ví dụ I-4: ^1H-NMR(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 8,6009 (2,9); 8,5966 (3,0); 8,4574 (3,0); 8,4536 (2,8); 8,3150 (0,4); 4,0311 (16,0); 3,8012 (14,7); 3,3214 (181,0); 2,9991 (1,2); 2,9804 (3,9); 2,9622 (4,0); 2,9436 (1,3); 2,6708 (2,0); 2,5020 (358,8); 2,3286 (2,1); 2,1919 (0,7); 2,1827 (0,8); 2,1703 (1,2); 2,1588 (0,8); 2,1505 (0,7); 2,1381 (0,4); 2,0859 (0,5); 1,2341 (0,6); 1,1183 (4,2); 1,0998 (8,6); 1,0816 (4,1); 1,0511 (0,6); 1,0330 (2,5); 1,0256 (1,4); 1,0191 (1,5); 1,0130 (2,2); 1,0066 (1,5); 0,9907 (1,2); 0,9828 (2,4); 0,9775 (2,9); 0,9712 (2,5); 0,9654 (1,9); 0,9517 (0,6); 0,1465 (0,4); 0,0000 (88,2); -0,1488 (0,4)
Ví dụ I-5: ^1H-NMR(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,0858 (4,0); 8,1341 (4,3); 4,1389 (16,0); 3,8029 (14,9); 3,3219 (123,8); 2,9817 (1,3); 2,9633 (4,0); 2,9449 (4,1); 2,9265 (1,3); 2,6709 (0,9); 2,5058 (131,1); 2,5017 (167,0); 2,4975 (123,0); 2,3283 (1,0); 2,1943 (0,6); 2,1863 (0,7); 2,1739 (1,1); 2,1618 (0,7); 2,1539 (0,6); 2,1413 (0,3); 1,1063 (4,3); 1,0880 (8,8); 1,0695 (4,1); 1,0540 (0,6); 1,0418 (1,4); 1,0355 (2,4); 1,0285 (1,4); 1,0214 (1,5); 1,0153 (2,1); 1,0085 (1,4); 0,9924 (1,2); 0,9849 (2,3); 0,9796 (2,8); 0,9729 (2,4); 0,9671 (1,8); 0,9543 (0,6); -0,0003 (25,9)

Ví dụ I-6: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,5373$ (2,0); $8,5315$ (2,2); $8,2860$ (2,0); $8,2831$ (2,0); $5,7552$ (0,6); $3,9793$ (14,2); $3,7887$ (16,0); $3,7374$ (1,0); $3,7190$ (3,3); $3,7005$ (3,4); $3,6821$ (1,0); $3,3197$ (28,5); $2,6711$ (0,4); $2,5241$ (1,0); $2,5064$ (49,7); $2,5020$ (65,8); $2,4976$ (47,9); $2,3290$ (0,4); $2,2471$ (0,6); $2,2386$ (0,6); $2,2265$ (1,1); $2,2144$ (0,7); $2,2062$ (0,6); $1,2780$ (3,6); $1,2596$ (7,9); $1,2411$ (3,6); $1,1082$ (0,5); $1,0960$ (1,3); $1,0895$ (2,1); $1,0820$ (1,3); $1,0755$ (1,2); $1,0691$ (2,1); $1,0617$ (0,9); $1,0526$ (0,4); $1,0470$ (0,3); $1,0316$ (1,0); $1,0238$ (2,1); $1,0184$ (2,1); $1,0119$ (2,3); $1,0057$ (1,7); $0,9938$ (0,5); $0,0075$ (0,8); $-0,0002$ (22,7); $-0,0083$ (1,0)

Ví dụ I-7: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 8,8889$ (2,5); $8,8843$ (2,6); $8,6319$ (2,4); $8,6275$ (2,4); $5,7559$ (6,7); $3,9884$ (14,2); $3,8424$ (16,0); $3,7470$ (1,0); $3,7286$ (3,3); $3,7101$ (3,4); $3,6917$ (1,0); $3,3233$ (89,2); $2,6712$ (0,4); $2,6666$ (0,3); $2,5244$ (1,0); $2,5110$ (26,2); $2,5067$ (54,8); $2,5022$ (73,5); $2,4977$ (53,2); $2,4934$ (26,0); $2,3289$ (0,4); $2,2579$ (0,6); $2,2495$ (0,6); $2,2373$ (1,1); $2,2252$ (0,7); $2,2170$ (0,6); $1,3976$ (0,9); $1,2855$ (3,6); $1,2671$ (7,9); $1,2486$ (3,5); $1,2355$ (0,5); $1,1158$ (0,5); $1,1037$ (1,3); $1,0972$ (2,1); $1,0895$ (1,3); $1,0832$ (1,2); $1,0769$ (1,9); $1,0694$ (0,9); $1,0581$ (0,4); $1,0372$ (1,1); $1,0294$ (2,0); $1,0240$ (2,0); $1,0175$ (2,3); $1,0113$ (1,7); $0,9993$ (0,5); $0,0078$ (0,6); $-0,0002$ (20,0); $-0,0082$ (0,9)

Ví dụ I-8: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,0939$ (2,8); $9,0885$ (3,0); $8,9022$ (2,6); $8,8972$ (2,6); $8,3141$ (0,5); $5,7547$ (0,9); $3,9937$ (14,2); $3,9689$ (0,4); $3,8786$ (16,0); $3,7535$ (0,9); $3,7352$ (3,2); $3,7168$ (3,3); $3,6984$ (1,1); $3,3974$ (0,4); $3,3304$ (359,6); $3,3284$ (350,0); $2,6753$ (1,5); $2,6713$ (1,9); $2,6667$ (1,5); $2,5241$ (4,9); $2,5065$ (267,4); $2,5021$ (349,9); $2,4977$ (254,8); $2,3332$ (1,5); $2,3288$ (2,0); $2,3244$ (1,5); $2,2637$ (0,6); $2,2560$ (0,6); $2,2439$ (1,2); $2,2319$ (0,7); $2,2229$ (0,6); $2,2114$ (0,4); $1,2867$ (3,5); $1,2683$ (7,9); $1,2500$ (3,5); $1,1199$ (0,6); $1,1082$ (1,2); $1,1015$ (2,0); $1,0942$ (1,3); $1,0877$ (1,2); $1,0816$ (1,9); $1,0742$ (0,9); $1,0627$ (0,4); $1,0416$ (1,1); $1,0337$ (2,1); $1,0284$ (2,0); $1,0220$ (2,3); $1,0158$ (1,8); $0,1458$ (0,4); $0,0079$ (3,5); $-0,0002$ (106,0); $-0,0083$ (4,5); $-0,1498$ (0,4)

Ví dụ I-9: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,1784$ (3,8); $8,1965$ (4,0); $5,7561$ (3,7); $3,9829$ (14,7); $3,9122$ (16,0); $3,7131$ (1,0); $3,6947$ (3,4); $3,6762$ (3,4); $3,6577$ (1,0); $3,3254$ (49,6); $2,5249$ (0,5); $2,5113$ (12,9); $2,5070$ (27,1); $2,5025$ (36,4); $2,4981$ (26,3); $2,4937$ (12,8); $2,2532$ (0,6); $2,2449$ (0,7); $2,2326$ (1,1); $2,2205$ (0,7); $2,2124$ (0,6); $2,0864$ (2,3); $1,3973$ (1,7); $1,2719$ (3,6); $1,2535$ (8,1); $1,2350$ (3,6); $1,1119$ (0,5); $1,0999$ (1,2); $1,0934$ (2,1); $1,0856$ (1,2); $1,0793$ (1,2); $1,0728$ (2,0); $1,0653$ (0,9); $1,0575$ (0,4); $1,0364$ (1,0); $1,0285$ (2,0); $1,0231$ (2,0); $1,0165$ (2,3); $1,0103$ (1,7); $0,9982$ (0,5); $0,0079$ (0,6); $-0,0002$ (17,6); $-0,0083$ (0,7)

Ví dụ I-10: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,2269$ (0,5); $9,1820$ (3,9); $8,2490$ (0,5); $8,1990$ (4,1); $5,7580$ (6,0); $4,5075$ (0,7); $4,4897$ (2,4); $4,4718$ (2,4); $4,4541$ (0,7); $4,3550$ (0,6); $4,0057$ (0,6); $3,9916$ (0,6); $3,9821$ (1,8); $3,9262$ (16,0); $3,8175$ (0,4); $3,7989$ (0,4); $3,7653$ (1,0); $3,7468$ (3,4); $3,7283$ (3,4); $3,7100$ (1,0); $3,3233$ (12,5); $2,5250$ (0,5); $2,5112$ (13,4); $2,5071$ (27,0); $2,5028$ (35,5); $2,4983$ (25,4); $2,2781$ (0,6); $2,2700$ (0,6); $2,2575$ (1,1); $2,2455$ (0,6); $2,2375$ (0,6); $1,4719$ (2,6); $1,4542$ (6,1); $1,4439$ (1,1); $1,4365$ (2,7); $1,4266$ (1,1); $1,4089$ (0,4); $1,3021$ (0,5); $1,2987$ (0,6); $1,2897$ (0,5); $1,2799$ (1,3); $1,2743$ (3,7); $1,2558$ (8,0); $1,2374$ (3,7); $1,1340$ (0,5); $1,1216$ (1,2); $1,1152$ (2,1); $1,1077$ (1,2); $1,1008$ (1,4); $1,0951$ (1,9); $1,0875$ (1,0); $1,0747$ (0,4); $1,0653$ (1,0); $1,0576$ (2,3); $1,0523$ (2,1); $1,0459$ (2,2); $1,0396$ (1,6); $1,0275$ (0,5); $-0,0002$ (0,7)

Ví dụ I-11: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,1739$ (4,2); $8,1837$ (4,4); $5,3190$ (0,3); $5,3014$ (0,9); $5,2839$ (1,3); $5,2662$ (1,0); $5,2492$ (0,4); $3,8730$ (16,0); $3,6436$ (1,0); $3,6253$ (3,4); $3,6067$ (3,4); $3,5884$ (1,0); $3,3220$ (67,8); $2,6705$ (0,7); $2,5057$ (90,9); $2,5014$ (117,8); $2,4971$ (85,1); $2,3575$ (0,6); $2,3518$ (0,7); $2,3387$ (1,3); $2,3319$ (1,1); $2,3273$ (1,2); $1,7008$ (13,4); $1,6832$ (13,3); $1,3973$ (1,1); $1,2796$ (3,6); $1,2612$ (8,0); $1,2428$ (3,6); $1,1254$ (2,6); $1,1051$ (4,1); $1,1013$ (4,0); $1,0930$ (2,7); $1,0887$ (2,9); $-0,0003$ (0,7)
Ví dụ I-12: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 8,6935$ (2,8); $8,6888$ (3,0); $8,5473$ (2,8); $8,5427$ (2,7); $5,7582$ (9,7); $4,0004$ (0,9); $3,9889$ (14,1); $3,9296$ (0,4); $3,8864$ (0,7); $3,8484$ (0,4); $3,8078$ (16,0); $3,7447$ (1,2); $3,7263$ (3,5); $3,7078$ (3,5); $3,6894$ (1,1); $3,3278$ (6,4); $2,5105$ (8,6); $2,5061$ (11,5); $2,5017$ (8,4); $2,2539$ (0,6); $2,2457$ (0,7); $2,2333$ (1,2); $2,2213$ (0,7); $2,2131$ (0,6); $1,3957$ (2,3); $1,2868$ (3,8); $1,2684$ (8,0); $1,2498$ (3,6); $1,1128$ (0,5); $1,1009$ (1,4); $1,0944$ (2,2); $1,0867$ (1,4); $1,0803$ (1,3); $1,0739$ (2,1); $1,0665$ (1,0); $1,0580$ (0,4); $1,0525$ (0,3); $1,0375$ (1,1); $1,0296$ (2,2); $1,0243$ (2,2); $1,0177$ (2,4); $1,0114$ (1,8); $0,9994$ (0,5); $0,0076$ (0,5); $-0,0002$ (14,7); $-0,0082$ (0,7)
Ví dụ I-13: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,1866$ (4,1); $8,1997$ (4,4); $3,9497$ (16,0); $3,9042$ (14,6); $3,7334$ (1,0); $3,7149$ (3,4); $3,6964$ (3,4); $3,6781$ (1,1); $3,3199$ (45,0); $3,0125$ (0,5); $3,0045$ (0,3); $2,9933$ (0,6); $2,9845$ (1,0); $2,9763$ (0,6); $2,9645$ (0,3); $2,9559$ (0,5); $2,6752$ (0,6); $2,6710$ (0,8); $2,6666$ (0,6); $2,5239$ (1,9); $2,5063$ (106,9); $2,5019$ (143,4); $2,4975$ (106,4); $2,3331$ (0,7); $2,3286$ (0,9); $2,3241$ (0,7); $1,9578$ (1,2); $1,9272$ (1,4); $1,8217$ (1,2); $1,7892$ (1,4); $1,7260$ (0,6); $1,6942$ (0,7); $1,6196$ (0,5); $1,6116$ (0,5); $1,5869$ (1,3); $1,5510$ (1,4); $1,5261$ (0,6); $1,5197$ (0,6); $1,4752$ (0,6); $1,4429$ (1,3); $1,4110$ (1,5); $1,3982$ (12,4); $1,3799$ (0,7); $1,3034$ (0,5); $1,2689$ (4,3); $1,2504$ (8,6); $1,2319$ (4,1); $1,2107$ (0,4); $0,0081$ (0,4); $0,0001$ (12,5)
Ví dụ I-14: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,2002$ (0,4); $9,1870$ (4,0); $8,2166$ (0,4); $8,2002$ (4,3); $3,9504$ (16,0); $3,9009$ (14,1); $3,7241$ (1,0); $3,7057$ (3,3); $3,6871$ (3,4); $3,6687$ (1,0); $3,3220$ (12,6); $2,9290$ (0,3); $2,9159$ (0,6); $2,9039$ (0,7); $2,8903$ (0,6); $2,8784$ (0,4); $2,5251$ (0,6); $2,5114$ (13,7); $2,5073$ (28,8); $2,5028$ (38,6); $2,4983$ (28,3); $2,4942$ (14,1); $2,0866$ (0,9); $1,7924$ (1,7); $1,7823$ (2,1); $1,7681$ (2,4); $1,7595$ (1,9); $1,7372$ (0,7); $1,7287$ (0,9); $1,4974$ (1,2); $1,4661$ (1,9); $1,4106$ (1,0); $1,3974$ (3,6); $1,3804$ (1,1); $1,3679$ (1,1); $1,3493$ (0,5); $1,3354$ (0,4); $1,2656$ (3,7); $1,2472$ (8,0); $1,2287$ (3,5); $0,9867$ (2,0); $0,9562$ (10,4); $0,9428$ (11,5); $0,0078$ (1,2); $-0,0002$ (37,0); $-0,0084$ (1,7)
Ví dụ I-15: $^1\text{H-NMR}$(400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,1971$ (1,7); $9,1871$ (1,2); $8,3148$ (0,6); $8,2075$ (1,8); $8,2018$ (1,3); $3,9878$ (6,8); $3,9428$ (4,9); $3,9216$ (4,3); $3,8932$ (6,1); $3,8040$ (0,4); $3,7860$ (1,4); $3,7675$ (1,4); $3,7489$ (0,4); $3,7115$ (1,0); $3,6928$ (1,0); $3,4178$ (0,4); $3,4061$ (0,5); $3,3186$ (181,5); $2,6796$ (1,0); $2,6749$ (1,9); $2,6704$ (2,8); $2,6659$ (2,1); $2,5237$ (9,6); $2,5189$ (14,7); $2,5103$ (172,2); $2,5058$ (362,1); $2,5013$ (487,1); $2,4967$ (350,9); $2,4923$ (170,5); $2,3371$ (1,0); $2,3326$ (2,1); $2,3280$ (2,8); $2,3235$ (2,1); $2,0857$ (0,9); $2,0413$ (0,7); $1,9977$ (0,7); $1,9547$ (0,7); $1,9221$ (0,5); $1,8910$ (0,4); $1,8656$ (0,4); $1,8343$ (0,4); $1,7600$ (0,5); $1,7526$ (0,5); $1,7295$ (0,5); $1,6936$ (0,4); $1,6544$ (0,4); $1,5091$ (0,4); $1,4781$ (0,4); $1,3980$ (16,0); $1,3000$ (1,5); $1,2815$ (3,5); $1,2680$ (1,4); $1,2630$ (1,7); $1,2497$ (2,5); $1,2313$ (1,1); $0,1459$ (1,8); $0,0079$ (15,6); $-0,0002$ (441,7); $-0,0085$ (18,5); $-0,1496$ (1,8)

Ví dụ I-16: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,1883$ (4,6); $8,2050$ (4,4); $8,1970$ (3,2); $5,7558$ (14,8); $3,9755$ (16,0); $3,9436$ (11,4); $3,9044$ (10,4); $3,8916$ (14,5); $3,7532$ (1,0); $3,7349$ (3,4); $3,7271$ (1,1); $3,7164$ (3,6); $3,7086$ (2,7); $3,6979$ (1,3); $3,6901$ (2,5); $3,6717$ (0,7); $3,3249$ (48,6); $3,1587$ (0,5); $3,1498$ (0,6); $3,1399$ (0,8); $3,1296$ (0,6); $3,1213$ (0,5); $2,9232$ (0,4); $2,9151$ (0,6); $2,9064$ (0,4); $2,8855$ (0,4); $2,5256$ (0,9); $2,5120$ (19,1); $2,5077$ (40,6); $2,5032$ (55,6); $2,4987$ (41,3); $2,4944$ (20,9); $2,3301$ (0,3); $1,9679$ (0,8); $1,9381$ (1,0); $1,9195$ (0,4); $1,9091$ (0,4); $1,8975$ (0,6); $1,8862$ (0,9); $1,8757$ (0,8); $1,8647$ (1,1); $1,8552$ (1,0); $1,8442$ (0,7); $1,8346$ (0,6); $1,7898$ (1,0); $1,7593$ (2,2); $1,7409$ (1,7); $1,7295$ (1,2); $1,7173$ (0,8); $1,7077$ (0,8); $1,6971$ (0,4); $1,6567$ (0,6); $1,6482$ (0,9); $1,6378$ (0,7); $1,6250$ (1,9); $1,6157$ (2,2); $1,6046$ (1,4); $1,5932$ (1,9); $1,5840$ (1,4); $1,5607$ (1,4); $1,5515$ (1,4); $1,5337$ (0,8); $1,5187$ (0,5); $1,4335$ (0,3); $1,4268$ (0,3); $1,4190$ (0,4); $1,3972$ (3,4); $1,2779$ (3,7); $1,2666$ (3,2); $1,2596$ (8,5); $1,2483$ (6,3); $1,2411$ (4,1); $1,2297$ (2,7); $1,1697$ (0,4); $1,1620$ (0,4); $1,1374$ (0,9); $1,0995$ (0,8); $0,9614$ (6,7); $0,9443$ (6,5); $0,9287$ (4,0); $0,9125$ (3,8); $0,0079$ (2,1); $-0,0002$ (63,1); $-0,0085$ (3,0)

Ví dụ I-17: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 1,02\text{-}1,13$ (m, 4H), $1,27$ (t, 3H), $2,23\text{-}2,28$ (m, 1H), $3,73$ (q, 2H), $4,00$ (s, 3H), $4,02$ (s, 3H), $8,65$ (s, 1H).

Ví dụ I-18: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 0,99\text{-}1,13$ (m, 4H), $1,25$ (t, 3H), $2,23\text{-}2,30$ (m, 1H), $3,64$ (q, 2H), $3,99$ (s, 3H), $8,78$ (s, 1H), $8,90$ (s, 1H), $9,22$ (s, 1H).

Ví dụ I-19: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 0,99\text{-}1,12$ (m, 4H), $1,24$ (t, 3H), $2,24\text{-}2,30$ (m, 1H), $3,63$ (q, 2H), $3,99$ (s, 3H), $8,24$ (s, 1H), $9,19$ (s, 1H), $9,41$ (s, 1H).

Các ví dụ sử dụng

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

Đối với lớp phủ của các ống thử nghiệm, 9 mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 μl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống 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 $44,7\text{cm}^2$, dựa trên sự phân bố đồng đều, đạt được liều theo diện tích là $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$.

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

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu đạt được hiệu quả ít nhất 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$. Hiệu quả 100% có nghĩa là tất cả 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 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (=500 g/ha): I-1, I-2

Rhipicephalus sanguineus - thử nghiệm tiếp xúc in vitro với tích chó nâu trưởng thành

Đối với lớp phủ của các ống thử nghiệm, 9 mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 μl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống 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 $44,7\text{cm}^2$, dựa trên sự phân bố đồng đều, đạt được liều theo diện tích là $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$.

Sau khi dung môi đã được làm bay hơi, 5 đến 10 con tích chó trưởng thành (*Rhipicephalus sanguineus*) được đưa vào các ống, đậy kín bằng nắp nhựa có đục lỗ và được ủ ở vị trí nằm ngang trong bóng tối ở nhiệt độ trong phòng và ở độ ẩm môi trường. Hiệu quả được xác định sau thời gian 48 giờ. Về điểm này, những con tích bị hạ gục xuống đáy ống và được ủ trên tấm hâm nóng ở nhiệt độ $45-50^\circ\text{C}$ trong thời gian tối đa 5 phút. Những con tích mà nằm bất động ở đáy hoặc di chuyển theo kiểu không điều phối khiến cho chúng không thể nỗ lực thoát khỏi nhiệt nóng bằng cách leo lên phía trên được coi là bị chết hoặc gần chết.

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Rhipicephalus sanguineus* tốt nếu đạt được hiệu quả ít nhất 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$. Hiệu quả 100% có nghĩa là tất cả tích bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là không có con tích 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 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ (=500 g/ha): I-2

Ctenocephalides felis - thử nghiệm qua đường miệng

Dung môi: dimetyl sulfoxit

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

Khoảng 20 bộ chết mèo 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/chế phẩm chứa hoạt chất, mà có thể được bộ chết hút qua màng parafilm.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100ppm: I-2, I-7, I-8

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 100ppm: I-1, I-11

Thử nghiệm với *Lucilia cuprina*

Dung môi: dimetyl sulfoxit

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

Khoảng 20 ấu trùng L1 của nhặng cừu Úc (*Lucilia cuprina*) được chuyển vào bình thử nghiệm chứa thịt ngựa băm và chế phẩm chứa hoạt chất có nồng độ mong muốn.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100ppm: I-1, I-2, I-7, I-8, I-11

Thử nghiệm với *Musca domestica*

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 10mg hoạt chất 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 bột biến được xử lý bằng dung dịch đường và chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn được đưa vào 10 ruồi nhà trưởng thành (*Musca domestica*).

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả 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 100ppm: I-1

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 100ppm: I-2

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 20ppm: I-1

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20ppm: I-2

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 20ppm: I-7, I-8

***Myzus persicae* – thử nghiệm qua đường miệng**

Dung môi: 100 phần khối lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng của hoạt chất 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 quần 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 chết; 0% có nghĩa là không có rệp bị chết.

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 20ppm: I-1, I-2

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 4ppm: I-1, I-2, I-6, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-17

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 4ppm: I-16

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 0,8ppm: I-2, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-17

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 0,8ppm: I-15, I-16

Myzus persicae – thử nghiệm phun

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

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để sản xuất 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 hoạt chất 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 chết; 0% có nghĩa là không có rệp bị chết.

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 100g/ha: I-6, I-12

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-2, I-7, I-11, I-15, I-16, I-17

Phaedon cochleariae – thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần theo khối lượng axeton
1,5 phần khối lượng dimethylformamit
Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để sản xuất 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 hoạt chất có nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, được đưa vào các ấu trùng bọ cánh cứng mù tạc (*Phaedon cochleariae*).

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100g/ha: I-1, I-2, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-15, I-17

Spodoptera frugiperda – thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton
1,5 phần khối lượng dimethylformamit
Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để sản xuất 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 hoạt chất 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 tất cả 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 83% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-10, I-12

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 100g/ha: I-2, I-6, I-7, I-8

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 sản xuất 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 mật nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) ở tất cả các giai đoạn được phun chế phẩm chứa hoạt chất có nồng độ mong muốn.

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

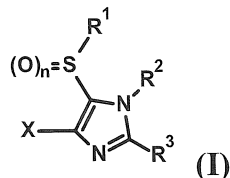
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100g/ha: I-1

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-6, I-16

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-2

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I)



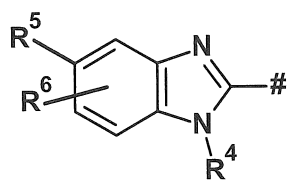
trong đó

R^1 là (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl hoặc (C₃-C₈)xycloalkyl,

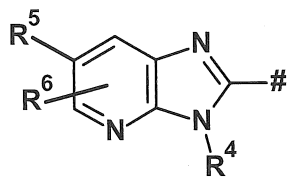
R^2 là hydro, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)alkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)alkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyloxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo(C₃-C₈)xycloalkyl, xyano(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl hoặc (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl,

R^3 là (C₃-C₈)xycloalkyl tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, halogen hoặc xyano,

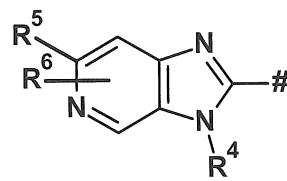
X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh ngưng tụ có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q18



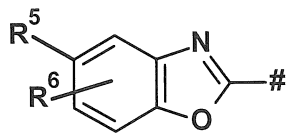
Q1



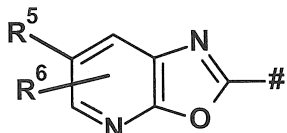
Q2



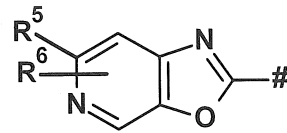
Q3



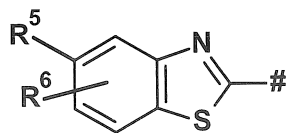
Q4



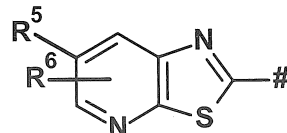
Q5



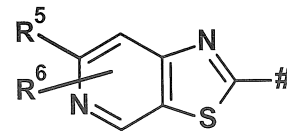
Q6



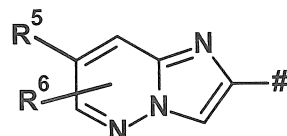
Q7



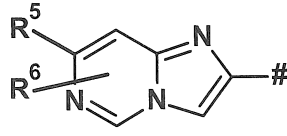
Q8



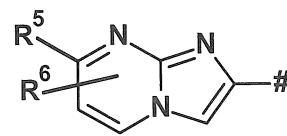
Q9



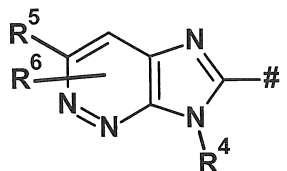
Q10



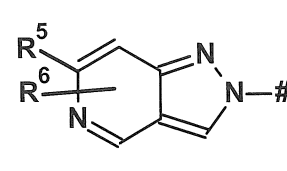
Q11



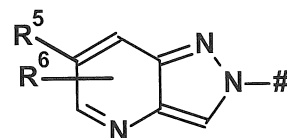
Q12



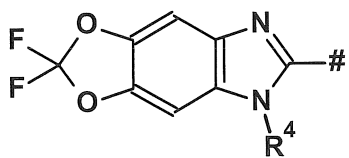
Q13



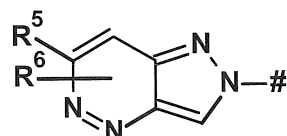
Q14



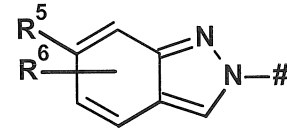
Q15



Q16



Q17



Q18

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, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₃-C₈)xycloalkyl, (C₃-C₈)xycloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₃-C₈)xycloalkyl, xyano-(C₃-C₈)xycloalkyl, halo-(C₃-C₈)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)haloalkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl hoặc di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

R^1 là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R^2 là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl,

R^3 là (C₃-C₆)xycloalkyl tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, aminocarbonyl, aminothiocarbonyl, halogen hoặc xyano,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh ngưng tụ có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm từ Q1 đến Q18,

R^4 là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R^5 , R^6 độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, xyano-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-haloalkoxyimino, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)-alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)-haloalkylcarbonyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

R^1 là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl hoặc (C₃-C₆)-xycloalkyl,

R^2 là hydro, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl hoặc halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl,

R^3 là (C₃-C₆)-xycloalkyl tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, halogen hoặc xyano,

X là hệ vòng dị vòng thơm có 9 cạnh hoặc 12 cạnh ngưng tụ có hai vòng hoặc ba vòng từ nhóm bao gồm Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17 hoặc Q18,

R^4 là hydro, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl hoặc (C₃-C₆)-xycloalkyl,

R^5 là halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, xyano-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-haloalkoxyimino, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyloxy,

(C₁-C₄)alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,

R⁶ là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

R¹ là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R² là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R³ là xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl tùy ý được thế một lần hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: metyl, etyl, n-propyl, i-propyl, xyclopropyl, diflometyl, triflometyl, xyano, flo hoặc clo,

X là Q1, Q2, Q3, Q10, Q11, Q13, Q14, Q15 hoặc Q17,

R⁴ là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R⁵ là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,

R⁶ là hydro, xyano, metyl, triflometyl, flo hoặc clo,

n bằng 0, 1 hoặc 2.

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

R¹ là etyl,

R² là metyl, etyl hoặc isopropyl,

R³ là xyclopropyl (không được thế) hoặc xyclohexyl tùy ý được thế một lần

hoặc hai lần, giống nhau hoặc khác nhau, trong đó các phần tử thể có thể là: methyl hoặc triflometyl,

X là Q2, Q3, Q13, Q14 hoặc Q15,

R⁴ là methyl,

R⁵ là triflometyl, triflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfinyl hoặc triflometylsulfonyl,

R⁶ là hydro,

n bằng 0 hoặc 2.

6. Chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, và chất độn và/hoặc chất hoạt động bề mặt.
7. Chế phẩm hóa nông theo điểm 6, trong đó chế phẩm này còn chứa hoạt chất hóa nông khác.
8. Phương pháp phòng trừ động vật gây hại, khác biệt ở chỗ hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông theo mỗi điểm trong số các điểm 6 và 7 được cho tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng, loại trừ phương pháp phẫu thuật hoặc điều trị trị liệu cho cơ thể động vật hoặc người và phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.