



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

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

(11)



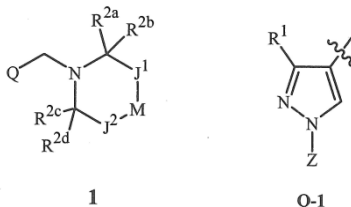
1-0039391

(51)⁷ C07D 401/06; C07D 401/04; C07D
413/06; C07D 403/06; A01N 43/58

(13) B

- (21) 1-2016-01825 (22) 20/11/2014
(86) PCT/US2014/066580 20/11/2014 (87) WO2015/077436 28/05/2015
(30) 61/906,595 20/11/2013 US
(45) 25/04/2024 433 (43) 25/08/2016 341A
(73) FMC CORPORATION (US)
2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America
(72) AHMAD Omar Khaled (PK); PAHUTSKI JR. Thomas Francis (US).
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT TRỪ SÂU 1-ARYL-3-ALKYLPYRAZOL, CHẾ PHẨM CHỨA NÓ,
HẠT ĐÃ ĐƯỢC XỬ LÝ BẰNG HỢP CHẤT TRỪ SÂU NÀY VÀ PHƯƠNG
PHÁP PHÒNG TRỪ LOÀI GÂY HẠI KHÔNG XƯƠNG SỐNG



Q-1

(57)

Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức **1**, bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình và chất đồng phân lập thể, *N*-oxit, và muối của chúng, trong đó: Q có công thức Q-1 và Z, R¹, R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, J¹, J² và M là như được xác định trong phần mô tả. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất có công thức **1** và phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

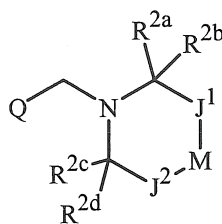
Sáng chế đề cập đến các hợp chất pyrazol nhất định, *N*-oxit, muối của chúng và các chế phẩm chứa chúng thích hợp để dùng trong lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp, và phương pháp sử dụng chúng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống như động vật chân khớp trong cả môi trường nông nghiệp lẫn môi trường phi nông nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Để đạt được năng suất thu hoạch cao thì việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống là điều vô cùng quan trọng. Thiệt hại do các loài gây hại không xương sống gây ra đối với cây trồng đang sinh trưởng và nông sản trong quá trình bảo quản có thể làm giảm đáng kể năng suất và do đó dẫn đến việc làm tăng chi phí cho người tiêu dùng. Việc phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong lâm nghiệp, cây trồng trong nhà kính, cây cảnh, vườn ươm, lương thực trong quá trình bảo quản và các sản phẩm sợi, gia súc, đồ gia dụng, lớp đất mặt, các sản phẩm gỗ, và trong chăm sóc sức khỏe cộng đồng và thú y cũng là rất quan trọng. Nhiều sản phẩm đáp ứng được các mục đích này hiện có bán trên thị trường, nhưng vẫn cần có các hợp chất mới có hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, độ độc thấp hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có các vị trí tác động khác nhau.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

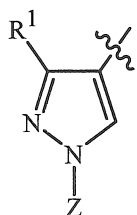
Sáng chế đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình và chất đồng phân lập thể), *N*-oxit, và muối của chúng, và chế phẩm chứa chúng và sử dụng chúng để phòng trừ các loài gây hại không xương sống:



1

trong đó:

Q có công thức:



Q-1 ;

R^1 là C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl hoặc C_2 – C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$, $SO_2NR^{9a}R^{10a}$, $Si(R^{14})_3$ và Z^1 ; hoặc

R^1 là vòng có 3 đến 10 cạnh bão hoà một phần hoặc hoàn toàn hoặc hệ vòng có 7 đến 11 cạnh bão hoà một phần hoặc hoàn toàn, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các thành viên vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 O, tối đa 2 S, và tối đa 4 N, trong đó tối đa 3 thành viên vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và thành viên vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 4 R^4 ;

Z là phenyl được thế bằng 1 đến 3 R^4 ; hoặc Z là vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ nhân hai vòng dị thơm có 8 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

Z^1 là vòng có 3 đến 10 cạnh hoặc hệ vòng có 7 đến 11 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các thành viên vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa 4 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ tối đa 2 O, tối đa 2 S, và tối đa 4 N, trong đó tối đa 3 thành viên vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và thành viên vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh độc lập được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 4 R⁴;

R^{2a} và R^{2c} độc lập với nhau là H, halogen, xyano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, OR¹² hoặc S(O)_nR¹¹; hoặc C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₃–C₆ xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a}, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl và S(O)_nR^{11a};

R^{2b} và R^{2d} độc lập với nhau là H, halogen, xyano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, OR¹², S(O)_nR¹¹ hoặc SO₂NR⁹R¹⁰; hoặc C₁–C₆ alkyl, C₂–C₆ alkenyl, C₂–C₆ alkynyl, C₃–C₇ xycloalkyl, C₄–C₈ xycloalkylalkyl hoặc C₃–C₆ xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a}, C₁–C₄ alkyl, C₁–C₄ haloalkyl và S(O)_nR^{11a}; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R⁴;

J¹ là liên kết trực tiếp, –C(R^{3a}R^{3b})– hoặc –C(R^{3a}R^{3b})C(R^{3a}R^{3b})–;

J² là liên kết trực tiếp hoặc –C(R^{3c}R^{3d})–;

M là –C(R^{3e})(A)–, –N(A¹)–, –O– hoặc –S(O)_n–;

A là halogen, xyano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ hoặc $SO_2NR^9R^{10}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(O)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl, vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ vòng dị thơm có 7 đến 11 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

A^1 là xyano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ hoặc $SO_2NR^9R^{10}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(O)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl, vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc hệ vòng dị thơm có 7 đến 11 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ; hoặc benzyl không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

mỗi R^{3a} và R^{3c} độc lập với nhau là H, halogen, xyano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, OR^{12} hoặc $S(O)_nR^{11}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$;

mỗi R^{3b} và R^{3d} độc lập với nhau là H, halogen, xyano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ hoặc $SO_2NR^9R^{10}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

R^{3e} là H, halogen, xyano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ hoặc $SO_2NR^9R^{10}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl, C_4-C_8 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

R^{3e} và A có thể cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo ra vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các thành viên vòng được chọn từ nguyên tử cacbon và tối đa 2 nguyên tử khác loại độc lập được chọn từ một nguyên tử oxy, một nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 2 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 thành viên vòng chứa nguyên tử cacbon độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và thành viên vòng chứa nguyên tử lưu huỳnh được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế bằng tối đa 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, và C_1-C_4 alkyl;

hoặc nếu hai gốc bất kỳ trong số các gốc R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} hoặc R^{3e} độc lập là C_1 – C_4 alkyl, thì hai gốc R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} hoặc R^{3e} có thể cùng nhau tạo thành vòng; mỗi R^4 độc lập là halogen, xyano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ hoặc $SO_2NR^9R^{10}$; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_7 xycloalkyl hoặc C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; mỗi R^5 độc lập là H; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_7 xycloalkyl hoặc C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ; mỗi R^{5a} độc lập là C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl; mỗi R^6 độc lập là C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_7 xycloalkyl hoặc C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1 – C_4 alkyl, C_1 – C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ; mỗi R^{6a} độc lập là C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl; mỗi R^7 và R^8 độc lập là H; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_7 xycloalkyl hoặc C_4 – C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập

được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ;

mỗi R^{7a} và R^{8a} độc lập là H, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

mỗi R^9 và R^{10} độc lập là H, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$ hoặc $C(X)NR^7R^8$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl hoặc C_4-C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ;

mỗi R^{9a} và R^{10a} độc lập là H, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

mỗi R^{11} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl hoặc C_4-C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ;

mỗi R^{11a} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

mỗi R^{12} độc lập là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl hoặc C_4-C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4

haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^{13} ; mỗi R^{12a} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; mỗi R^{13} độc lập là halogen, xyano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$ hoặc $SO_2NR^{9a}R^{10a}$; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_7 xycloalkyl hoặc C_4-C_8 xycloalkylalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phân tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, OR^{12a} , C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl và $S(O)_nR^{11a}$;

mỗi R^{14} độc lập là C_1-C_4 alkyl;

mỗi X độc lập là O hoặc S; và

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2.

Sáng chế cũng đề xuất hợp chất có công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân dị hình và chất đồng phân lập thể), N-oxit, và muối của chúng, như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trên đây, với điều kiện R^1 không phải là metyl.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng. Theo một phương án, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này còn chứa ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng (ví dụ, chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này). Sáng chế

cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống, trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó được cho tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này còn chứa ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của chế phẩm bất kỳ trong số các chế phẩm nêu trên, trong đó môi trường này là thực vật.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của chế phẩm bất kỳ trong số các chế phẩm nêu trên, trong đó môi trường này là động vật.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của chế phẩm bất kỳ trong số các chế phẩm nêu trên, trong đó môi trường này là hạt.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống bao gồm bước cho hạt này tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này). Sáng chế cũng đề xuất hạt được xử lý (tức là hạt được cho tiếp xúc với hợp chất có công thức I).

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt mà từ đó cây trồng này được sinh trưởng hoặc vị trí (ví dụ, môi trường sinh trưởng) của cây trồng, tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất có công thức I (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này).

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả này, các thuật ngữ "bao gồm", "chứa", "có", "khác biệt ở chỗ" hoặc các biến thể bất kỳ của chúng, được dự định để bao hàm đối tượng, nội dung không mang tính loại trừ trong giới hạn bất kỳ được biểu thị một cách rõ ràng. Ví dụ, chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp bao gồm các phần tử thì nó không nhất thiết chỉ giới hạn ở các phần tử này mà có thể bao gồm các yếu tố khác được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có đối với các chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp như vậy.

Cụm từ "chứa" không bao gồm các yếu tố, bước hoặc thành phần bất kỳ không được nêu cụ thể. Nếu trong yêu cầu bảo hộ thì cụm từ này sẽ giới hạn yêu cầu bảo hộ ở các chất ngoài các chất được nêu ngoại trừ các tạp chất thường liên quan đến nó. Nếu cụm từ "chứa" xuất hiện trong mệnh đề của phần nội dung trong yêu cầu bảo hộ, chứ không phải xuất hiện sau phần mở đầu, thì nó chỉ giới hạn yếu tố nêu trong mệnh đề đó; các yếu tố khác không bị loại trừ toàn bộ khỏi yêu cầu bảo hộ.

Cụm từ "về cơ bản chứa" được sử dụng để xác định chế phẩm hoặc phương pháp bao gồm các chất, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố, ngoài các chất, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố được đề cập trong bản mô tả, với điều kiện các chất, các bước, các dấu hiệu, các thành phần hoặc các yếu tố bổ sung này không gây ảnh hưởng nhiều đến các đặc điểm đặc trưng cơ bản và mới của đối tượng sáng chế. Thuật ngữ "về cơ bản chứa" ở mức độ giữa "bao gồm" và "chứa".

Khi Người nộp đơn xác định sáng chế hoặc một phần của nó bằng thuật ngữ có kết mở như "bao gồm", cần phải hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả cũng là để mô tả sáng chế này bằng cách sử dụng các thuật ngữ "về cơ bản chứa" hoặc "chứa".

Ngoài ra, trừ khi có quy định khác, "hoặc" được dùng để chỉ sự bao hàm và không phải là loại trừ. Ví dụ, điều kiện "A hoặc B" thỏa mãn một trường hợp trong số các trường hợp bất kỳ trong các trường hợp sau: A đúng (hoặc có mặt) và

B sai (hoặc không có mặt), A sai (hoặc không có mặt) và B đúng (hoặc có mặt), và cả A và B đều đúng (hoặc có mặt).

Hơn nữa, các mạo từ không xác định "một" đứng trước phần tử hoặc thành phần theo sáng chế được dự định dùng để chỉ một cách không giới hạn một số trường hợp (tức là biến) của phần tử hoặc thành phần này. Vì vậy "một" phải được hiểu là bao hàm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của phần tử hoặc thành phần này cũng bao hàm cả số nhiều trừ khi số này có nghĩa rõ ràng là số ít.

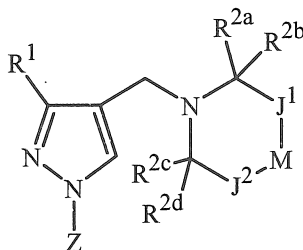
Trong bản mô tả này, thuật ngữ "loài gây hại không xương sống" bao gồm các loài gây hại là động vật chân khớp, động vật chân bụng và giun tròn gây ảnh hưởng về mặt kinh tế. Thuật ngữ "động vật chân khớp" bao gồm côn trùng, bét, nhện, bọ cạp, rết, động vật nhiều chân, rệp tròn và loài chân rết. Thuật ngữ "động vật chân bụng" bao gồm ốc sên, sên và các loài thuộc Bộ ốc cạn (nhóm Mất cuống) khác. Thuật ngữ "giun tròn" bao gồm tất cả các sinh vật sống thuộc bộ Giun tròn Phylum. Thuật ngữ "giun tròn" bao gồm tất cả các loài giun sán như giun hình tim, và giun tròn ăn thực vật (Nematoda), sán lá (Tematoda), Acanthocephala, và sán xơ mít (Cestoda).

Trong bản mô tả này, "phòng trừ loài gây hại không xương sống" nghĩa là ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (bao gồm tỷ lệ chết, làm giảm đáng kể sự tiếp nhận thức ăn và/hoặc phá vỡ quá trình giao cấu; và các biểu hiện liên quan được xác định một cách tương tự.

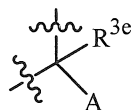
Thuật ngữ "nông nghiệp" được dùng để chỉ việc sản xuất cây trồng trên cánh đồng dùng làm lương thực và sợi và bao gồm quá trình sinh trưởng của ngô, đậu tương và các cây họ đậu khác, lúa, ngũ cốc (ví dụ, lúa mỳ, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, gạo, ngô), các loại rau lấy lá (ví dụ, rau diếp, cải bắp, và các cây trồng bao cánh khác), các loại rau lấy quả (ví dụ, cà chua, hồ tiêu, cà, cải bắp và bầu bí), khoai tây, khoai tây ngọt, nho, bông, các cây ăn quả (ví dụ, táo, quả hột cứng và cam quýt), quả nhỏ (trứng cá, anh đào) và cây trồng đặc sản khác (ví dụ, cây cải dầu, cây hướng dương, oliu). Thuật ngữ "phi nông nghiệp" được dùng để chỉ các cây trồng khác ngoài cây trồng trên cánh đồng như cây trồng trong vườn (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây cảnh không được trồng ngoài cánh đồng), các công trình nhà ở, nông nghiệp, thương mại và các khu công nghiệp, lớp đất

mặt (ví dụ, trang trại trồng cỏ, sân gôn, nhà ở, khu vui chơi giải trí, v...v.), các sản phẩm gỗ, sản phẩm bảo quản, các ứng dụng trong quản lý nông lâm nghiệp và rau quả, chăm sóc sức khỏe cộng đồng (tức là con người) và thú y (tức là động vật nuôi trong nhà như động vật cảnh, gia súc và gia cầm, các động vật chưa thuần hoá như động vật hoang dã).

Đường lượn sóng trong một phần cấu trúc dùng để chỉ điểm gắn kết của phần này với phần còn lại của phân tử. Ví dụ, khi Q biến thiên trong công thức 1 được xác định là **Q-1**, thì đường lượn sóng chia đôi liên kết ở vị trí thứ 4 của pyrazol **Q-1** có nghĩa là pyrazol **Q-1** được gắn với phần còn lại của cấu trúc có công thức 1 ở vị trí thứ 4 này, như được thể hiện dưới đây.



Khi M biến thiên được xác định là $-C(R^{3e})(A)-$, điều này tương đương với thành viên vòng chứa nguyên tử cacbon được thế bằng một R^{3e} và một A như được thể hiện dưới đây.



Trong các phần mô tả nêu trên, thuật ngữ “alkyl”, được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “alkylthio” hoặc “haloalkyl” bao gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metyl, etyl, *n*-propyl, *i*-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl, pentyl hoặc hexyl khác nhau. “Alkenyl” bao gồm alken mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, và các chất đồng phân khác nhau butenyl, pentenyl và hexenyl. “Alkenyl” cũng bao gồm polyen như 1,2-propadienyl và 2,4-hexadienyl. “Alkynyl” bao gồm alkyn mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propynyl, 2-propynyl và các chất đồng phân butynyl, pentynyl và hexynyl khác nhau. “Alkynyl” cũng có thể bao gồm các góc chứa nhiều liên kết ba như 2,5-hexadiynyl.

“Alkoxy” bao gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy và các chất đồng phân butoxy, pentoxy và hexyloxy khác nhau. “Alkoxyalkyl” để chỉ việc thay thế alkoxy trên alkyl. Ví dụ về “alkoxyalkyl” bao gồm CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ và $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

“Xycloalkyl” bao gồm, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl.

Thuật ngữ “halogen”, khi được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Ngoài ra, khi được sử dụng trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” thì alkyl này có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng nguyên tử halogen có thể là giống nhau hoặc khác nhau. Ví dụ về “haloalkyl” hoặc “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- và CF_3CCl_2- .

Các từ viết tắt hóa học $\text{S}(\text{O})$ và $\text{S}(=\text{O})$ khi được sử dụng trong bản mô tả này là gốc sulfinyl. Các từ viết tắt hóa học SO_2 , $\text{S}(\text{O})_2$ và $\text{S}(=\text{O})_2$ khi được sử dụng trong bản mô tả này là gốc sulfonyl. Các từ viết tắt hóa học $\text{C}(\text{O})$ và $\text{C}(=\text{O})$ khi được sử dụng trong bản mô tả này là gốc cacbonyl. Các từ viết tắt hóa học CO_2 , $\text{C}(\text{O})\text{O}$ và $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ khi được sử dụng trong bản mô tả này là gốc oxycacbonyl. “CHO” nghĩa là formyl.

Tổng số nguyên tử cacbon trong nhóm thế được biểu thị bằng tiền tố “Ci-Cj”, trong đó i và j là các số từ 1 đến 6. Ví dụ, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkylsulfonyl bao gồm methylsulfonyl đến butyl. Ví dụ, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl bao gồm methyl đến butyl; C_2 alkoxyalkyl bao gồm CH_3OCH_2- ; C_3 alkoxyalkyl bao gồm, ví dụ, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ hoặc $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; và C_4 alkoxyalkyl bao gồm các chất đồng phân khác nhau của nhóm alkyl được thế bằng nhóm alkoxy chứa tổng bốn nguyên tử cacbon, ví dụ, bao gồm $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ và $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

Khi hợp chất được thể bằng phân tử thể mang chỉ số dưới biểu thị số phân tử thể có thể vượt quá 1, phân tử thể này (khi chúng vượt quá 1) độc lập được chọn từ nhóm các phân tử thể đã xác định, ví dụ, $(R^X)_m$, m bằng 0, 1, 2 hoặc 3. Ngoài ra, khi chỉ số dưới biểu thị một khoảng, ví dụ $(R)_{i-j}$, thì số phân tử thể có thể được chọn từ các số nguyên nằm trong khoảng và bao gồm cả i và j . Khi nhóm chứa phân tử thể có thể là hydro, ví dụ, R^{3a} hoặc R^{3c} , thì khi phân tử thể này được lấy dưới dạng hydro, cần phải hiểu rằng phân tử này là tương đương với nhóm không được thể. Khi nói rằng một hoặc nhiều vị trí trên nhóm là “không thể” hoặc “không được thể”, thì có nghĩa là nguyên tử hydro được gắn để mang hóa trị tự do bất kỳ.

Trừ khi có quy định khác, “vòng” hoặc “hệ vòng” dưới dạng thành phần của công thức 1 là vòng cacbon hoặc dị vòng. Thuật ngữ “hệ vòng” để chỉ hai hoặc nhiều vòng ngưng tụ. Các thuật ngữ “hệ nhân hai vòng” và “hệ nhân hai vòng ngưng tụ” để chỉ hệ vòng bao gồm hai vòng ngưng tụ, có thể là “được ngưng tụ ở vị trí ortho”, “hai vòng được liên kết cầu nối” hoặc “hai vòng spiro”. “Hệ nhân hai vòng ngưng tụ ở vị trí ortho” để chỉ hệ vòng, trong đó hai vòng thành phần có chung hai nguyên tử liền kề. “Hệ nhân hai vòng được liên kết cầu nối” được tạo ra bằng cách liên kết một phần của một hoặc nhiều nguyên tử với nhân vòng không liền kề của vòng. “Hệ nhân hai vòng spiro” được tạo ra bằng cách liên kết một phần của hai hoặc nhiều nguyên tử với cùng thành viên vòng của vòng. Thuật ngữ “hệ nhân dị hai vòng ngưng tụ” để chỉ hệ nhân hai vòng ngưng tụ, trong đó ít nhất một nguyên tử vòng không phải là cacbon. Thuật ngữ “thành viên vòng” được dùng để chỉ nguyên tử hoặc gốc khác (ví dụ, $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$) tạo thành mạch chính của vòng hoặc hệ vòng.

Các thuật ngữ “nhân dị vòng”, “dị vòng” hoặc “hệ nhân dị vòng” để chỉ vòng hoặc hệ vòng, trong đó ít nhất một nguyên tử tạo thành mạch chính của vòng không phải là cacbon, ví dụ, nitơ, oxy hoặc lưu huỳnh. Thông thường, nhân dị vòng chứa không quá 4 nguyên tử nitơ, không quá 2 nguyên tử oxy và không quá 2 nguyên tử lưu huỳnh. Trừ khi có quy định khác, nhân vòng cacbon hoặc nhân dị vòng có thể là vòng bão hòa hoặc chưa bão hòa. “Bão hoà” được dùng để chỉ

vòng có mạch chính chứa nguyên tử được liên kết với nhau bằng các liên kết đơn; trừ khi có quy định khác, các hóa trị nguyên tử còn lại được sử dụng bởi nguyên tử hydro. Trừ khi có quy định khác, “vòng chưa bão hòa” có thể là chưa bão hòa một phần hoặc chưa bão hòa hoàn toàn. Cụm từ “vòng chưa bão hòa hoàn toàn” nghĩa là nguyên tử vòng, trong đó các liên kết giữa các nguyên tử trong vòng là liên kết đơn hoặc liên kết đôi theo lý thuyết liên kết hóa trị và hơn nữa các liên kết giữa các nguyên tử trong vòng bao gồm nhiều liên kết đôi có thể mà không có các liên kết đôi được tích lũy (tức là không có $C=C=C$ hoặc $C=C=N$). Thuật ngữ “vòng chưa bão hòa một phần” để chỉ vòng bao gồm ít nhất một thành viên vòng được liên kết với thành viên vòng liền kề qua liên kết đôi và làm thích ứng tiềm năng về mặt khái niệm một số các liên kết đôi không tích tụ giữa các nhân vòng liền kề (tức là ở dạng tương ứng chưa bão hòa hoàn toàn của nó) lớn hơn số các liên kết đôi có mặt (tức là ở dạng chưa bão hòa một phần của nó).

Trừ khi có quy định khác, nhân dị vòng và hệ nhân dị vòng có thể được gắn vào qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ sẵn có bất kỳ bằng cách thay thế nguyên tử hydro bằng nguyên tử cacbon hoặc nitơ này.

“Thơm” chỉ ra rằng mỗi nguyên tử vòng về cơ bản là trong cùng mặt tinh thể và có vuông góc quỹ đạo p với mặt tinh thể của vòng, và, trong đó $(4n + 2) \pi$ điện tử, trong đó n là số nguyên lớn hơn không, được đi liền với vòng để phù hợp với quy tắc Hückel. Thuật ngữ “hệ nhân thơm” để chỉ vòng cacbon hoặc hệ nhân dị vòng, trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng là thơm. Nếu nhân vòng cacbon chưa bão hòa hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này còn được gọi là “nhân thơm” hoặc “nhân vòng cacbon thơm”.

Thuật ngữ “hệ nhân vòng cacbon thơm” để chỉ hệ nhân vòng cacbon, trong đó ít nhất một nhân của hệ vòng là thơm. Nếu nhân dị vòng chưa bão hòa hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này là còn được gọi là “vòng dị thơm” hoặc “nhân dị vòng thơm”. Thuật ngữ “hệ nhân dị vòng thơm” để chỉ hệ nhân dị vòng, trong đó ít nhất một nhân của hệ vòng là thơm. Thuật ngữ “hệ nhân không thơm” để chỉ vòng cacbon hoặc hệ nhân dị vòng có thể là bão hòa hoàn toàn, cũng như bão hòa một phần hoặc chưa bão hòa hoàn toàn, với điều kiện tất cả các vòng trong hệ vòng đều không phải là thơm. Thuật ngữ “hệ nhân vòng cacbon không

thơm” để chỉ nhân vòng cacbon, trong đó tất cả các nhân trong hệ vòng đều không phải là thơm. Thuật ngữ “hệ nhân dị vòng không thơm” để chỉ hệ nhân dị vòng, trong đó tất cả các nhân trong hệ vòng đều không phải là thơm.

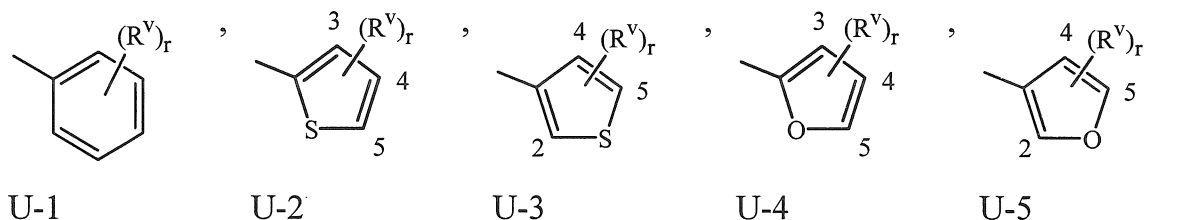
Thuật ngữ “tùy ý được thế” liên quan đến nhân dị vòng dùng để chỉ các nhóm không được thế hoặc có ít nhất một phần tử thế không có hydro không làm triệt tiêu hoạt tính sinh học đã có của chất tương tự không được thế. Khi được sử dụng trong bản mô tả này, định nghĩa sau sẽ được áp dụng, trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “tùy ý được thế” được sử dụng hoán đổi với cụm từ “được thế hoặc không được thế” hoặc với thuật ngữ “(không) được thế”. Trừ khi có quy định khác, nhóm tùy ý được thế có thể có phần tử thế ở mỗi vị trí thế của nhóm, và mỗi thay thế này là độc lập với nhau.

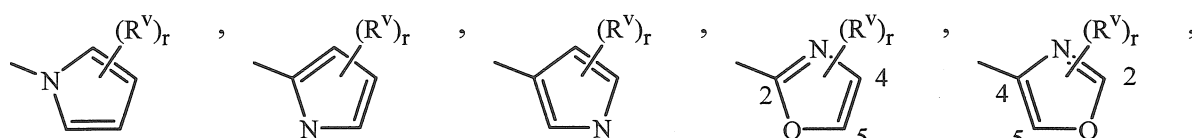
Khi phần tử thế là nhân dị vòng chứa nitơ có 5 hoặc 6 cạnh, nó có thể được gắn với phần còn lại có công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ sẵn có bất kỳ nguyên tử vòng, trừ khi có quy định khác trong bản mô tả.

Một ví dụ về phenyl tùy ý được thế bằng một đến năm phần tử thế là vòng được minh họa dưới dạng U-1 trong Bảng thể hiện 1.

Ví dụ về vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều phần tử thế bao gồm các vòng U-2 qua U-61 được minh họa trong Bảng thể hiện 1. Do U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 và U-43 chỉ có một vị trí sẵn có, đối với các nhóm U này r được giới hạn ở các số nguyên 0 hoặc 1, và r là 0 có nghĩa là nhóm U là không được thế và hydro có mặt ở vị trí được chỉ định bởi $(R^V)_r$.

Bảng thể hiện 1





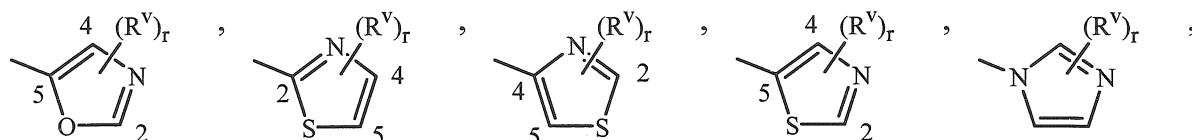
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



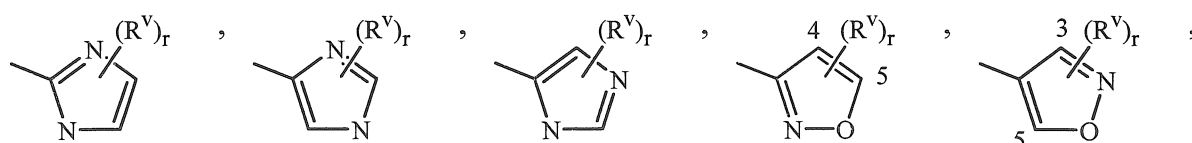
U-11

U-12

U-13

U-14

U-15



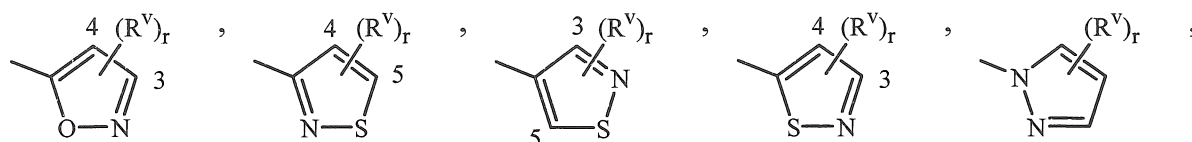
U-16

U-17

U-18

U-19

U-20



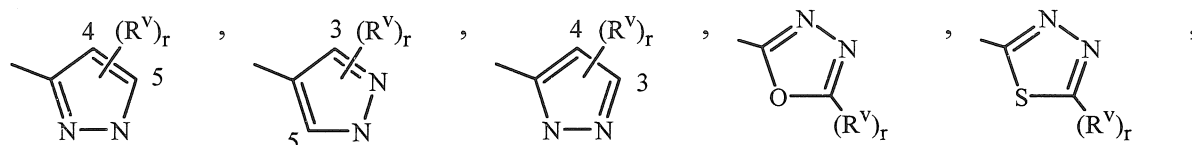
U-21

U-22

U-23

U-24

U-25



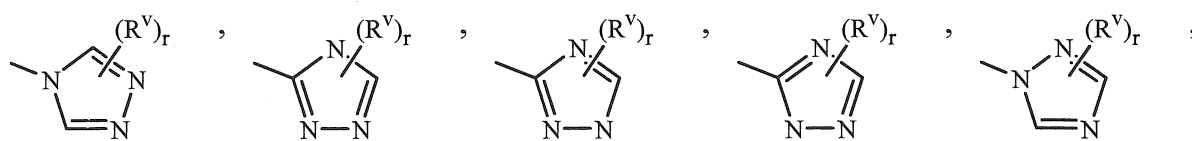
U-26

U-27

U-28

U-29

U-30



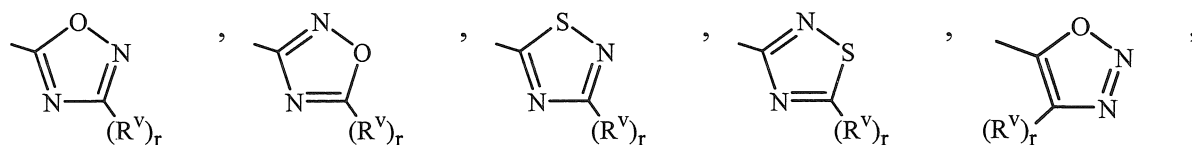
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



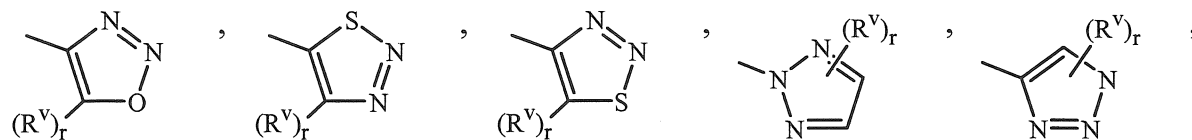
U-36

U-37

U-38

U-39

U-40



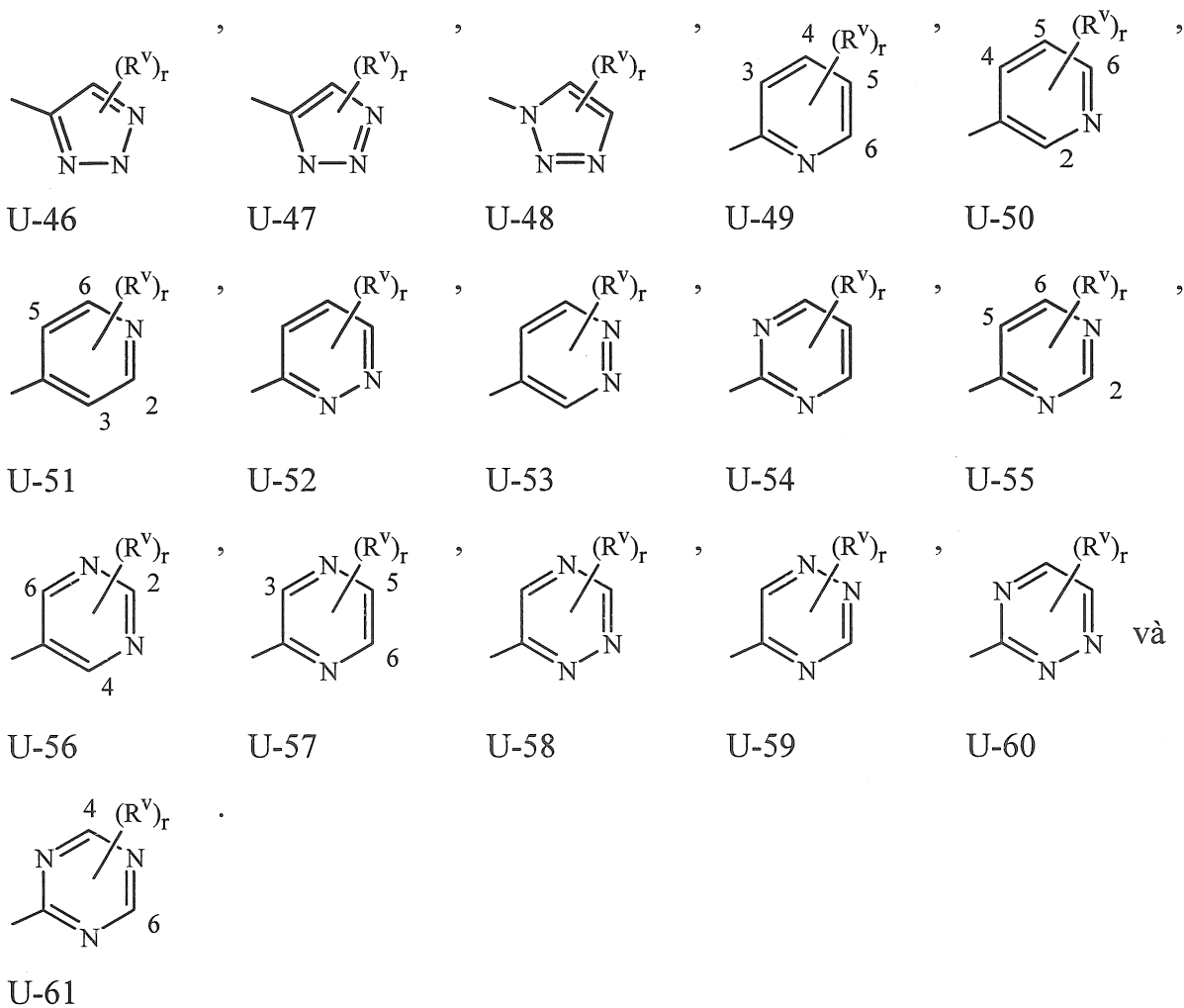
U-41

U-42

U-43

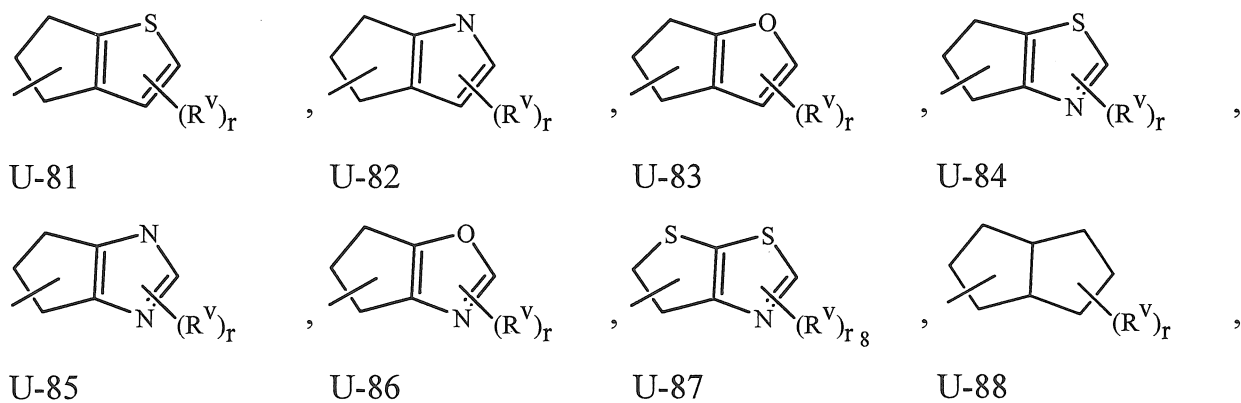
U-44

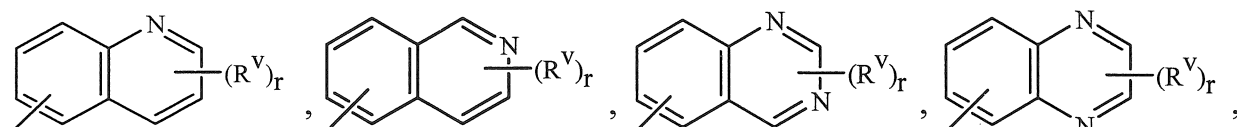
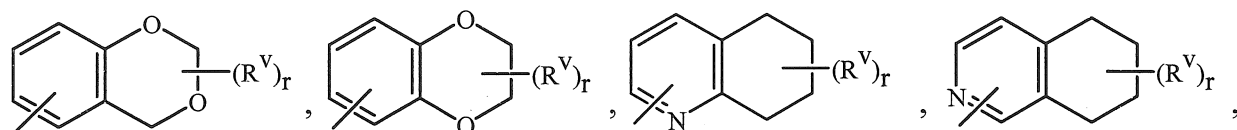
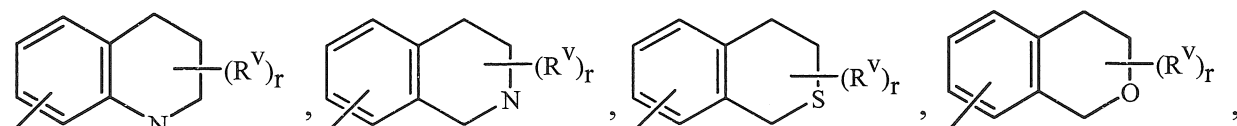
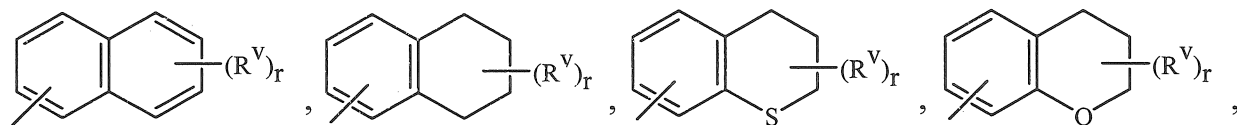
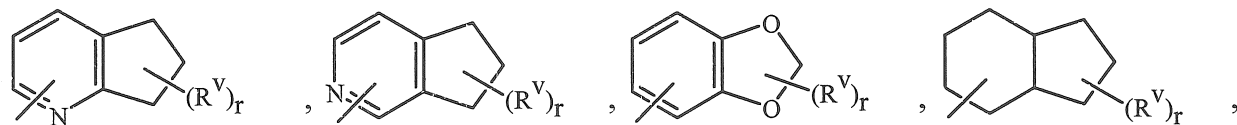
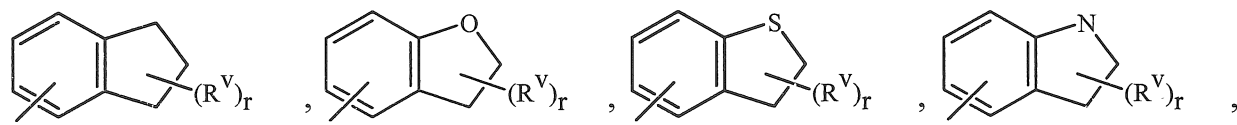
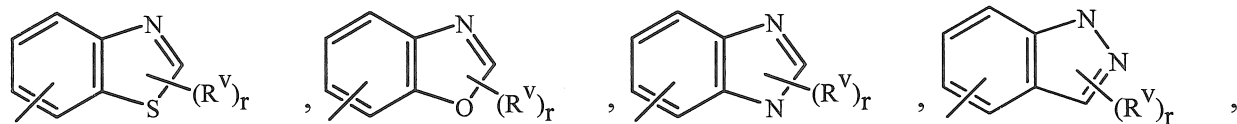
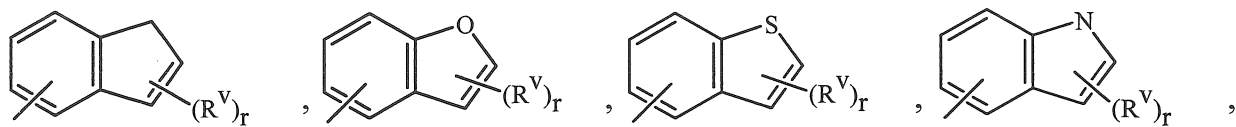
U-45

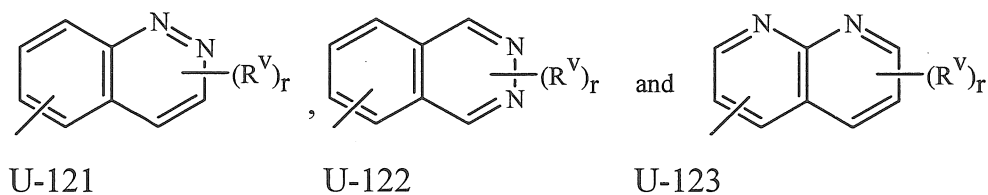


Ví dụ về hệ nhân hai vòng ngưng tụ có 8, 9 hoặc 10 cạnh ở vị trí g tùy ý được thể bằng một hoặc nhiều phần tử thể bao gồm các vòng U-81 qua U-123 được minh họa trong Bảng thể hiện 3.

Bảng thể hiện 3







Mặc dù các nhóm R^V được thể hiện trong các cấu trúc từ U-1 đến U-123, lưu ý rằng chúng không cần phải có mặt do chúng là phần tử thế tùy ý. Lưu ý rằng nếu R^V là H khi được gắn vào nguyên tử, thì nó là giống nhau vì nguyên tử này không được thế. Nguyên tử nitơ đòi hỏi việc thay thế để đáp ứng hóa trị của chúng được thế bằng H hoặc R^V . Lưu ý rằng khi điểm gắn kết giữa $(R^V)_r$ và nhóm U được minh họa như phần đệm, $(R^V)_r$ có thể được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nguyên tử nitơ sẵn có bất kỳ của nhóm U. Lưu ý rằng khi điểm gắn kết trên nhóm U được minh họa như phần đệm, nhóm U có thể được gắn vào phần còn lại của công thức 1 qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ sẵn có bất kỳ của nhóm U bằng cách thay thế nguyên tử hydro. Lưu ý rằng một số nhóm U chỉ có thể được thế bằng ít hơn 4 nhóm R^V (ví dụ, U-2 qua U-5, U-7 qua U-48, và U-52 qua U-61).

Có rất nhiều phương pháp tổng hợp đã được biết trong lĩnh vực này có thể điều chế nhân dị vòng thơm; để xem xét kỹ hơn xem bộ tám tập *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 và bộ mười hai tập *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Hợp chất theo sáng chế có thể có mặt dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân lập thể. Chất đồng phân lập thể là các chất đồng phân có cấu trúc giống nhau nhưng khác nhau về việc sắp xếp nguyên tử của chúng trong không gian và bao gồm chất đồng phân đối ảnh, chất đồng phân không đối quang, chất đồng phân cis-trans (còn gọi là chất đồng phân dị hình) và chất đồng phân atropy. Chất đồng phân atropy là kết quả của việc quay có hạn chế quanh các liên kết đơn mà tại đó hàng rào quay là đủ lớn để cho phép tách các chất đồng phân. Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cần hiểu rằng một chất đồng phân lập thể có thể hoạt động nhiều hơn và/hoặc có thể có các tác dụng có lợi khi được làm giàu tương đối so

với các chất đồng phân lập thể khác hoặc khi được tách khỏi các chất đồng phân lập thể khác. Ngoài ra, người có hiểu biết trong lĩnh vực này cũng biết cách để tách, làm giàu, và/hoặc điều chế một cách có chọn lọc các chất đồng phân lập thể này. Để xem xét toàn diện về tất cả các khía cạnh của chất đồng phân lập thể, xem Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Sáng chế bao hàm tất cả các chất đồng phân lập thể, chất đồng phân cấu hình và hỗn hợp của chúng ở tất cả các tỷ lệ cũng như các dạng đồng vị như hợp chất đơ tơ ri hóa.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cần hiểu rằng không phải tất cả các dị vòng chứa nitơ có thể tạo thành các *N*-oxit vì nitơ cần một cặp đơn lẻ để oxy hoá thành oxit; người có hiểu biết trong lĩnh vực này cần hiểu rằng các dị vòng chứa nitơ này có thể tạo thành các *N*-oxit. Người có hiểu biết trong lĩnh vực cũng cần hiểu rằng các amin bậc ba có thể tạo thành *N*-oxit. Các phương pháp tổng hợp để điều chế các *N*-oxit của các dị vòng và amin bậc ba là đã biết đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực này bao gồm phương pháp oxy hoá dị vòng và amin bậc ba bằng các axit peroxy như axit peraxetic và 3-cloperbenzoic (MCPBA), hydro peroxit, alkyl hydroperoxit như *t*-butyl hydroperoxit, natri perborat, và đioxiran như dimetyldioxiran. Các phương pháp điều chế các *N*-oxit này được mô tả rộng rãi và xem xét trong tài liệu, ví dụ: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng do trong môi trường và trong các điều kiện sinh lý học, các muối của hợp chất hoá học ở trạng

thái cân bằng với các dạng không muối tương ứng của chúng, các muối có tính hữu ích sinh học của các dạng không muối. Do đó, rất nhiều dạng muối của hợp chất có công thức 1 có thể dùng để phòng trừ loài gây hại không xương sống và các loài ký sinh động vật (tức là các loài thích hợp để sử dụng trong bảo vệ sức khỏe động vật). Các muối của hợp chất có công thức 1 bao gồm các muối cộng axit với các axit vô cơ hoặc hữu cơ như axit bromhydric, axit clohydric, axit nitric, axit phosphoric, axit lưu huỳnhic, axit axetic, axit butyric, axit fumaric, axit lactic, axit maleic, axit malonic, axit oxalic, axit propionic, axit salixylic, axit tartaric, axit 4-toluensulfonic hoặc axit valeric. Khi hợp chất có công thức 1 chứa gốc axit như axit carboxylic hoặc phenol, muối cũng bao gồm các muối được tạo ra từ các bazơ vô cơ hoặc hữu cơ như pyridin, triethylamin hoặc amoniac, hoặc amin, hydrit, hydroxit hoặc cacbonat của natri, kali, lithi, canxi, magie hoặc bari. Do đó, sáng chế bao gồm hợp chất được chọn từ các hợp chất có công thức 1, N-oxit và các muối thích hợp của chúng.

Hợp chất được chọn từ hợp chất có Công thức 1, chất đồng phân lập thể, chất hỗn biến, N-oxit, và muối của chúng, thường tồn tại ở nhiều hơn một dạng, và do đó công thức 1 bao gồm tất cả các dạng kết tinh và không kết tinh của hợp chất có công thức 1. Dạng không kết tinh bao gồm các phương án là chất rắn như sáp và gom cũng như các phương án là chất lỏng như dung dịch và chất nóng chảy. Dạng kết tinh bao gồm các phương án về cơ bản là dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp chứa chất đa hình (tức là các dạng tinh thể khác nhau). Thuật ngữ “dạng đa hình” được dùng để chỉ dạng kết tinh cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng kết tinh khác nhau, các dạng này có sự sắp xếp và/hoặc cấu dạng khác nhau của phân tử trong mạng tinh thể. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hóa học giống nhau, chúng cũng có thể khác nhau về thành phần do sự có mặt hoặc không có mặt của nước đồng kết tinh hoặc các phân tử khác, có thể được liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng này. Chất đa hình có thể khác về các đặc tính hóa học, vật lý và sinh học như hình dạng, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ ổn định hóa học, điểm nóng chảy, độ ẩm, độ nhạy, tốc độ hòa tan và tính sinh khả dụng của tinh thể. Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cần hiểu rằng chất đa hình của hợp chất có công thức 1 có thể có các tác dụng có lợi (ví dụ,

thích hợp để điều chế các chế phẩm hữu ích, đặc tính sinh học cải thiện) so với các chất đa hình khác hoặc hỗn hợp của chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách chất đa hình cụ thể của hợp chất có công thức 1 có thể đạt được bằng các phương pháp đã biết đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực này bao gồm, ví dụ, phương pháp kết tinh bằng cách sử dụng các dung môi và các nhiệt độ đã chọn. Để xem xét toàn diện về chất đa hình, xem R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Các phương án theo sáng chế như được mô tả trong Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Trong các phương án sau, "hợp chất có công thức 1" bao gồm xác định về phần tử thể được chỉ rõ trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi được xác định rõ hơn trong các phương án.

Phương án 1. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại.

Phương án 2. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^1 là xyclopentyl, tetrahydro-2-furanyl hoặc tetrahydro-3-furanyl.

Phương án 3. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl.

Phương án 4. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^1 là C_1 – C_6 alkyl được thế bằng Z^1 .

Phương án 5. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^1 là C_1 – C_6 alkyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$, $SO_2NR^{9a}R^{10a}$, $Si(R^{14})_3$ và Z^1 ; với điều kiện R^1 không phải là metyl không được thế.

Phương án 6. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là phenyl hoặc vòng dị thơm có 6 cạnh, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 6a. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 6b. Hợp chất có công thức 1 hoặc Phương án 6a, trong đó Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 ; và mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl.

Phương án 6c. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 .

Phương án 6d. Hợp chất có công thức 1 hoặc Phương án 6c, trong đó Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ; và mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl.

Phương án 6e. Hợp chất có công thức 1 hoặc Phương án 6d, trong đó Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ; và mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 6f. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là pyridinyl, được thế bằng 1 đến 2 R^4 ; và mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 .

Phương án 6g. Hợp chất có công thức 1, trong đó Z là pyridinyl, được thế bằng 1 R^4 ; và R^4 là CF_3 .

Phương án 7. Hợp chất có công thức 1, trong đó mỗi R_{2a} , R_{2b} , R_{2c} , và R_{2d} là H.

Phương án 8. Hợp chất có công thức 1, trong đó J^1 là $-C(R^{3a}R^{3b})-$ và J^2 là liên kết trực tiếp hoặc $-C(R^{3c}R^{3d})-$.

Phương án 8a. Hợp chất có công thức 1, trong đó J^1 là $-C(R^{3a}R^{3b})-$ và J^2 là liên kết trực tiếp.

Phương án 8b. Hợp chất có công thức 1, trong đó J^1 là $-C(R^{3a}R^{3b})-$ và J^2 là $-C(R^{3c}R^{3d})-$.

Phương án 8c. Hợp chất có công thức 1, trong đó J^1 và J^2 là CH_2 .

Phương án 9. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , và R^{3d} là H.

Phương án 10. Hợp chất có công thức 1, trong đó M là $-C(R^{3e})(A)-$.

Phương án 10a. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^{3e} là H, halogen hoặc C_1 – C_6 alkyl.

Phương án 10b. Hợp chất có công thức 1, trong đó R^{3e} là H.

Phương án 10c. Hợp chất có công thức 1, trong đó M là $-\text{CH}(\text{CN})-$ hoặc $-\text{CH}(\text{CF}_3)-$.

Phương án 10d. Hợp chất có công thức 1, trong đó M là $-\text{CH}(\text{CN})-$.

Phương án 11. Hợp chất có công thức 1 hoặc Phương án 10, trong đó A là xyano, C_1-C_4 haloalkyl, $\text{C}(\text{X})\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$, $\text{C}(\text{X})\text{NR}^7\text{R}^8$ hoặc NR^9R^{10} ; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 11a. Hợp chất theo phương án 11, trong đó A là xyano, C_1-C_4 haloalkyl, $\text{C}(\text{X})\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ hoặc NR^9R^{10} ; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 11b. Hợp chất theo phương án 11a, trong đó A là xyano, $\text{C}(\text{X})\text{R}^5$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ hoặc NR^9R^{10} .

Phương án 11c. Hợp chất theo phương án 11b, trong đó A là xyano, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{6a}$, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$ hoặc $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{6a}$.

Phương án 11d. Hợp chất theo phương án 11a, trong đó A là xyano, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{6a}$ hoặc $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$; hoặc vòng dị thơm có 5 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 11e. Hợp chất theo phương án 11a, trong đó A là $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$; hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án 11f. Hợp chất theo phương án 11a, trong đó A là xyano, C_1-C_4 haloalkyl, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án 11g. Hợp chất theo phương án 11a, trong đó A là xyano, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án 11h. Hợp chất có công thức 1, trong đó A là xyano hoặc CF_3 .

Phương án 11i. Hợp chất có công thức 1, trong đó A là xyano, C_1-C_4 haloalkyl, $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án 12. Hợp chất có công thức 1 hoặc phương án bất kỳ một trong số các phương án từ 1 đến 11i, trong đó X là O.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–12 nêu trên cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả ở đây, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và phần mô tả về các biến trong các phương án này không những đề cập đến hợp chất có công thức 1 mà còn đề cập đến các hợp chất ban đầu và các hợp chất trung gian hữu ích để điều chế hợp chất có công thức 1. Ngoài ra, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–12 nêu trên cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả ở đây, và tổ hợp bất kỳ của chúng, đề cập đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Tổ hợp của các phương án 1–12 được minh họa bằng:

Phương án A. Hợp chất có công thức 1, trong đó:

J^1 là $-C(R^{3a}R^{3b})-$;

J^2 là liên kết trực tiếp hoặc $-C(R^{3c}R^{3d})-$; và

M là $-C(R^{3e})(A)-$.

Phương án B. Hợp chất theo phương án A, trong đó:

X là O;

R^1 là C_1-C_6 alkyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$, $SO_2NR^{9a}R^{10a}$, $Si(R^{14})_3$ và Z^1 ; với điều kiện R^1 không phải là methyl không được thế; hoặc

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl; và

A là xyano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$ hoặc NR^9R^{10} ; hoặc C_1-C_6 haloalkyl; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án C. Hợp chất theo phương án B, trong đó

R^1 là C_1 – C_6 alkyl được thế bằng Z^1 ; hoặc

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl.

Phương án D. Hợp chất theo phương án C, trong đó

Z là phenyl hoặc pyridinyl được thế bằng 1 đến 3 R^4 ; và

A là xyano, C_1 – C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án E. Hợp chất theo phương án D, trong đó

R^{3e} là H; và

A là xyano hoặc CF_3 .

Phương án F. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $CHCN$ hoặc $CHCF_3$.

Phương án G. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc vòng dị thơm có 6 cạnh, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 là CH_2 ;

J^2 là liên kết trực tiếp hoặc CH_2 ;

M là $-CH(A)-$; và

A là xyano, C_1 – C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án G-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc vòng dị thơm có 6 cạnh, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ;

M là $-CH(A)-$; và

A là xyano, C_1 – C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án H. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ;

M là $-CH(A)-$ hoặc O; và

A là CN, C_1 – C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án H-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ;

M là $-CH(A)-$; và

A là CN, C_1-C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án I. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CN)-$ hoặc $-CH(CF_3)-$.

Phương án I-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CN)-$.

Phương án I-2. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CF_3)-$.

Phương án J. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CN)-$ hoặc $-CH(CF_3)-$.

Phương án J-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-\text{CH}(\text{CN})-$.

Phương án J-2. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-\text{CH}(\text{CF}_3)-$.

Phương án K. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là pyridinyl, được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-\text{CH}(\text{CN})-$ hoặc $-\text{CH}(\text{CF}_3)-$.

Phương án K-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là pyridinyl, được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CN)-$.

Phương án K-2. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là pyridinyl, được thế bằng 1 đến 2 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là F, Cl, Br hoặc CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CF_3)-$.

Phương án L-1. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là xyclopentyl, tetrahydro-2-furanyl hoặc tetrahydro-3-furanyl;

Z là pyridinyl, được thế bằng 1 R^4 ;

R^4 là CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CN)-$.

Phương án L-2. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là xyclopentyl, tetrahydro-2-furanyl hoặc tetrahydro-3-furanyl;

Z là pyridinyl, được thế bằng 1 R^4 ;

R^4 là CF_3 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H;

J^1 và J^2 là CH_2 ; và

M là $-CH(CF_3)-$.

Phương án M. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_1-C_6 alkyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử

thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro,

$C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$,

$SO_2NR^{9a}R^{10a}$, $Si(R^{14})_3$ và Z^1 ; với điều kiện R^1 không phải là methyl

không được thế; hoặc

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên

tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên

vòng còn lại;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

R^{3e} là H, halogen hoặc C_1-C_6 alkyl;

J^1 là $-C(R^{3a}R^{3b})-$;

J^2 là liên kết trực tiếp hoặc $-C(R^{3c}R^{3d})-$;

M là $-C(R^{3e})(A)-$ hoặc O; và

A là xyano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$ hoặc NR^9R^{10} ; hoặc C_1-C_6

haloalkyl; hoặc phenyl hoặc vòng dị thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng

này không được thế hoặc được thế bằng 1 đến 3 R^4 .

Phương án N. Hợp chất có công thức 1, trong đó

R^1 là C_3-C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên

tử oxy là một thành viên vòng và nguyên tử cacbon là các thành viên

vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc vòng dị thơm có 6 cạnh, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến

3 R^4 ;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

J^1 là CH_2 ;

J² là liên kết trực tiếp hoặc CH₂;

M là –CH(A)– ; và

A là xyano, C₁–C₄ haloalkyl, NHC(O)R^{5a} hoặc 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Phương án O. Hợp chất có công thức 1, trong đó

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R⁴; và

M là –CH(CN)– hoặc –CH(CF₃)–.

Các phương án cụ thể bao gồm hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm bao gồm (số hợp chất dùng để chỉ các Bảng chỉ số A-C):

2-[3-xyclohexyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin (hợp chất số 23);

2-[3-xyclopentyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin (hợp chất số 25);

1-[[3-xyclopentyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 26);

1-[[1-(4-clo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 38);

1-[[1-(5-bromo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 39);

1-[[3-xyclopentyl-1-(3,4-điclophenyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 40);

1-[[3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 43);

1-[[3-xyclobutyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 46);

1-[[3-xyclopentyl-1-(5-metyl-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 48);

2-[3-(1-metyletyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin (hợp chất số 54);

5-bromo-2-[3-xyclopentyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-

yl]pyridin (hợp chất số 65); và

1-[[1-(5-clo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril (hợp chất số 66).

Các phương án cụ thể cũng bao gồm hợp chất có công thức 1 được chọn từ nhóm bao gồm (số hợp chất dùng để chỉ các Bảng chỉ số A-C):

1-[[1-(4-clo-5-flo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-5-flo-2-pyridinyl)-3-(tetrahydro-2-furanyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-2-pyridinyl)-3-(tetrahydro-2-furanyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-5-flo-2-pyridinyl)-3-(1-metyletyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin;

4-clo-5-flo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin;

4-clo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin;

5-metyl-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin; và

5-clo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin.

Tốt hơn là hợp chất theo sáng chế được đặc trưng bởi sự chuyển hoá thuận lợi và/hoặc kiểu tồn dư đất và có hoạt tính phòng trừ phổ loài gây hại không xương sống trong nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Đặc biệt lưu ý là các phương án của sáng chế vì lý do phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống và ý nghĩa kinh tế, bảo vệ cây nông nghiệp khỏi thương tổn do loài gây hại không xương sống gây ra bằng cách phòng trừ loài gây hại không xương sống là. Hợp chất theo sáng chế được quan tâm vì đặc điểm hoán chuyển

thuận lợi của chúng hoặc nội hấp trong cây cũng bảo vệ lá hoặc các phần khác của cây không được tiếp xúc trực tiếp với hợp chất có công thức I hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

Cũng lưu ý là các phương án theo sáng chế là chế phẩm chứa các hợp chất như được mô tả trong phương án bất kỳ trong số các phương án trước đó, cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả ở đây, và hỗn hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn chứa lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Lưu ý hơn nữa là các phương án theo sáng chế về chế phẩm phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả ở đây, và tổ hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả ở đây).

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, ở dạng chế phẩm lỏng thấm vào đất. Các phương án theo sáng chế còn gồm phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống, bao gồm bước cho đất tiếp xúc với chế phẩm lỏng thấm vào đất chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất của các phương án bất kỳ trên đây.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm chế phẩm phun phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên và chất khí đẩy. Các phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm mồi để phòng trừ loài gây hại không xương sống chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số

các phương án nêu trên, một hoặc nhiều nguyên liệu thức ăn, tùy ý chất dẫn dụ, và tùy ý chất giữ ẩm. Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm dụng cụ phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm chế phẩm môi này và hộp phù hợp để chứa chế phẩm môi này, trong đó hộp này có ít nhất một lỗ hồng có độ lớn nhất định để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua sao cho loài gây hại không xương sống này có thể tiếp cận được với chế phẩm môi này từ địa điểm bên ngoài hộp, và trong đó hộp này còn phù hợp để được đặt trong hoặc gần khu vực hoạt động đã biết hoặc khu vực hoạt động tiềm năng của loài gây hại không xương sống.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống, bao gồm bước cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Phương án của sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ động vật khỏi loài ký sinh không xương sống, bao gồm bước cho động vật dùng lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

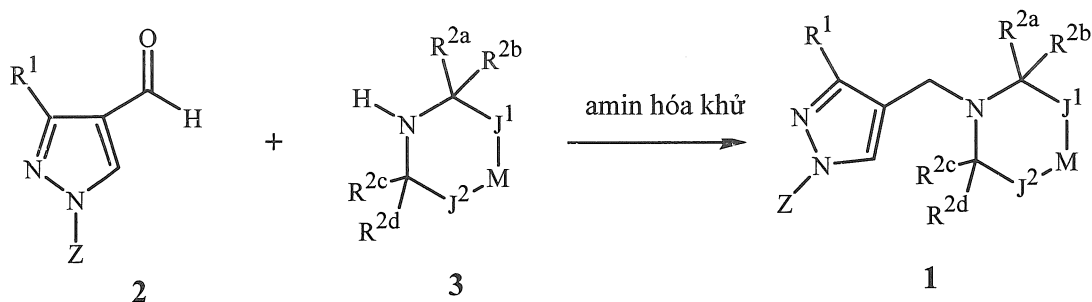
Phương án của sáng chế cũng bao gồm phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống, bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh chúng tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này), với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp điều trị bệnh cho người hoặc động vật.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp, trong đó loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh chúng được cho tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý chứa thêm ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung với lượng hữu hiệu sinh học, với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp điều trị bệnh cho người hoặc động vật.

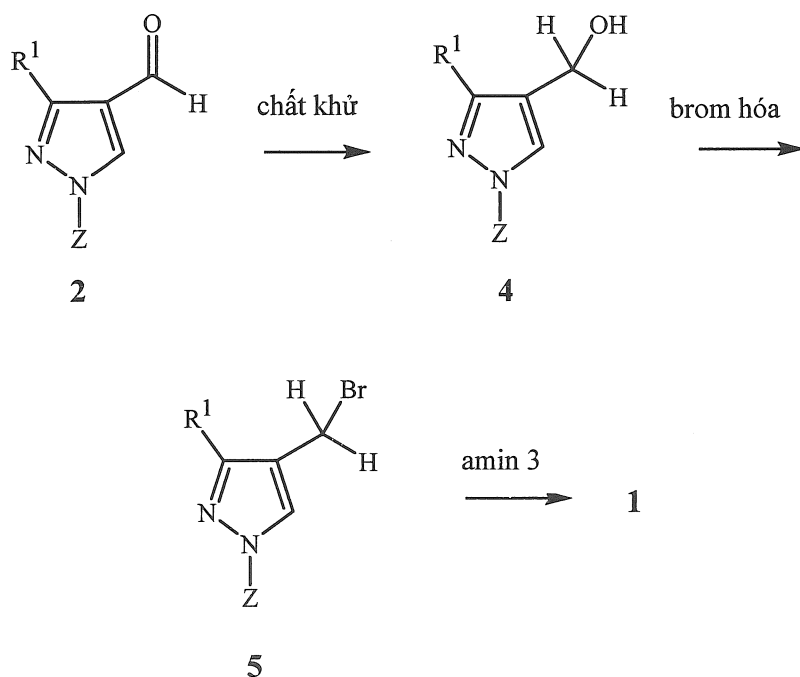
Một hoặc nhiều phương pháp và biến thể được mô tả trong các Sơ đồ 1–8 sau có thể được sử dụng để điều chế hợp chất có công thức **1**. Định nghĩa về phần tử thế trong các hợp chất có công thức **1–12** dưới đây là như được xác định trên đây trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, trừ khi có quy định khác. Các từ viết tắt sau được sử dụng: THF là tetrahydrofuran, DMF là *N,N*-dimetylformamit, NMP là *N*-metylpyrrolidinon, Ac là axetat, MS là mesylat, Tf là triflat, và Nf là nonaflat.

Hợp chất có công thức **1** có thể được điều chế bằng cách amin hóa khử một cách thích hợp hợp chất cacbonyl được thế có công thức **2** bằng amin vòng được thế tùy ý có công thức **3**, bằng cách sử dụng các chất phản ứng như natri triaxetoxyborohydrua (xem, ví dụ, Li, J. et al. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* **2010**, 20(16), các trang 4932-4935). Phản ứng thường được thực hiện trong dung môi hữu cơ trơ như diclometan ở nhiệt độ trong phòng.

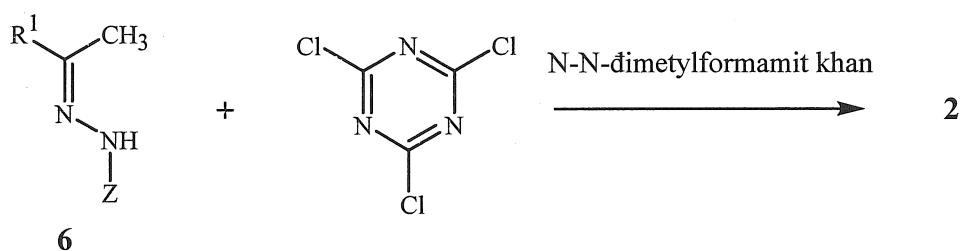
Sơ đồ 1



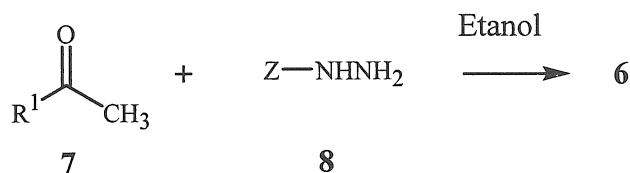
Hợp chất có công thức **1** cũng có thể được điều chế bằng cách phương pháp được thể hiện trong Sơ đồ 2, trong đó hợp chất cacbonyl được thế một cách thích hợp có công thức **2** được khử bằng chất khử như lithi nhôm hydrua trong dung môi trơ như dietylyl ete (xem, ví dụ, De Luca, Lidia; et al. *Synlett* **2004**, 13, các trang 2299-2302.) để tạo ra rượu trung gian có công thức **4**. Rượu được chuyển hóa thành bromua tương ứng có công thức **5** bằng cách xử lý bằng các chất phản ứng như HBr hoặc PBr₃ (xem, ví dụ, Toja, Emilio; et al. *European Journal of Medicinal Chemistry* **1982**, 17(3), các trang 223-227). Phản ứng của bromua có công thức **5** với amin có công thức **3** thu được hợp chất có công thức **1** (xem, ví dụ, Lee, Suk Ho, et al. *Journal of Medicinal Chemistry* **2008**, 51(22), các trang 7216-7233).

Sơ đồ 2

Hợp chất có công thức 2 có thể được điều chế bằng cách xử lý hydrazon được thể một cách thích hợp có công thức 6 trong các điều kiện khan bằng xyanuric clorua và *N,N*-đimetylformamit (xem, ví dụ, De Luca, Lidia; et al. *Synlett* **2004**, 13, các trang 2299-2302), như được thể hiện trong Sơ đồ 3.

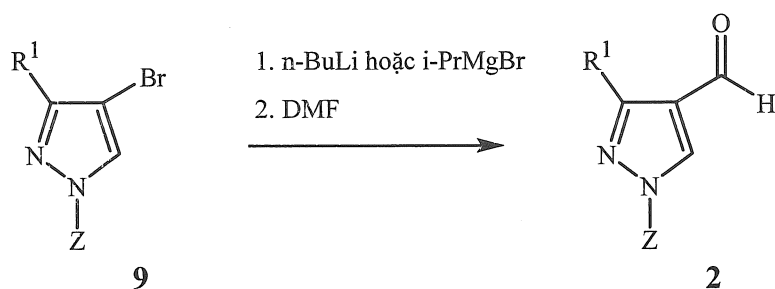
Sơ đồ 3

Hợp chất có công thức 6 có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp đã biết trong lĩnh vực này như ngưng tụ keton có công thức 7 với aryl hydrazin có công thức 8 trong etanol hồi lưu (xem, ví dụ, Goeker, Hakan; et al. *Journal of Heterocyclic Chemistry* **2009**, 46(5), các trang 936-948).

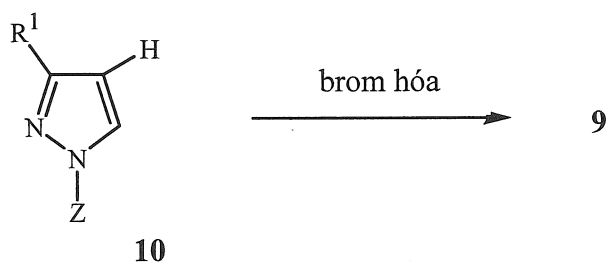
Sơ đồ 4

Hợp chất có công thức **3**, **7** và **8** là sẵn có trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng cách các phương pháp đã biết đã biết trong lĩnh vực này.

Hợp chất có công thức **2** cũng có thể được điều chế bằng cách phương pháp được thể hiện trong Sơ đồ 5. Trong phương pháp này, hợp chất có công thức **9** được xử lý bằng *n*-butyl lithi hoặc isopropyl magie bromua ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ -78 đến 0°C trong dung môi như THF hoặc hexan, tiếp theo là bổ sung dimethylformamit (xem, ví dụ, Arvantis, Argyrios G., et al. PCT Int. Appl. WO 2007038215 A1, và Fang, Kevin, et al. PCT Int. Appl. WO 2005044818 A2).

Sơ đồ 5

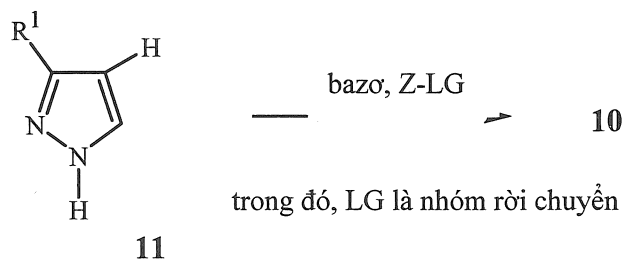
Hợp chất có công thức **9** có thể được điều chế bằng cách brom hóa hợp chất có công thức **10** bằng brom trong dung môi như axit axetic hoặc pyridin như được thể hiện trong Sơ đồ 6 (xem, ví dụ, Ichikawa, Hayato, et al. *Heterocycles*, **2010**, 81(6), các trang 1509-1516).

Sơ đồ 6

Hợp chất có công thức **10** có thể được điều chế bằng cách xử lý hợp chất có công thức **11** bằng bazơ như natri hydrua hoặc kali cacbonat và nhóm Z-LG, trong

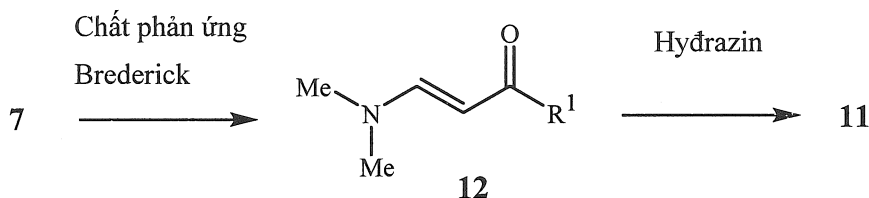
đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp, trong dung môi như đimetylformamit hoặc axetonitril như được thể hiện trong Sơ đồ 7 (xem, ví dụ, Brien, Kimberly A., et al. *Tetrahedron* **2006**, 62(15), các trang 3663-3666).

Sơ đồ 7



Hợp chất có công thức 11 có thể được tổng hợp bằng cách cho hợp chất có công thức 12 phản ứng với hydrazin trong dung môi phân cực. Hợp chất có công thức 12 có thể được điều chế bằng cách cho keton có công thức 7 phản ứng với chất phản ứng Brederick hoặc chất phản ứng tương tự như đimetylformamit dimetyl axetal như được thể hiện trong Sơ đồ 8 (xem, ví dụ, Parsy, Christopher Claude, et al. PCT Int. Appl. WO 2011017389).

Sơ đồ 8



Hợp chất có công thức 1 chứa các nhóm $C(X)R^5$, $C(X)R^{5a}$, $C(X)NR^7R^8$ và $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, trong đó X là S có thể được điều chế từ hợp chất tương ứng có công thức 1, trong đó X là O bằng các phương pháp chung đã biết trong lĩnh vực này bao gồm việc xử lý bằng chất phản ứng thionin hóa như P_4S_{10} hoặc chất phản ứng Lawesson (2,4-bis-(4-metoxypheyl)-1,3-dithia-2,4-diphosphetan 2,4-disulfua).

Cần phải hiểu rằng một số chất phản ứng và các điều kiện phản ứng được mô tả trên đây để điều chế hợp chất có công thức 1 có thể không tương hợp với một số chức có mặt trong các sản phẩm trung gian. Trong các trường hợp này, việc đưa trình tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc hoán chuyển nhóm chức vào quy trình

tổng hợp sẽ giúp thu được các sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ là dễ dàng đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực tổng hợp hóa học (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cần hiểu rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng như được thể hiện trong các sơ đồ riêng rẽ, có thể cần thực hiện bước tổng hợp bổ sung không được mô tả chi tiết để hoàn thành quy trình tổng hợp hợp chất có công thức 1. Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng có thể cần thực hiện kết hợp các bước được minh họa trong các sơ đồ trên đây theo một trình tự ngoài trình tự được thể hiện cụ thể để điều chế hợp chất có công thức 1.

Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng hợp chất có công thức 1 và các sản phẩm trung gian được mô tả ở đây có thể tham gia vào các phản ứng ưa điện tử, ái nhân, gốc, kim loại hữu cơ, oxy hoá, và khử để bổ sung phân tử thể hoặc cải biến phân tử thể đang có.

Không cần mô tả chi tiết hơn, tin rằng người có hiểu biết trong lĩnh vực này bằng cách sử dụng phần mô tả trên đây có thể sử dụng sáng chế ở phạm vi rộng nhất của nó. Vì vậy, các Ví dụ tổng hợp sau chỉ minh họa và không giới hạn phần mô tả theo cách bất kỳ. Các bước trong các Ví dụ tổng hợp minh họa quy trình cho mỗi bước trong toàn bộ một quá trình chuyển hóa, và nguyên liệu ban đầu cho mỗi bước có thể không nhất thiết được điều chế bằng con đường điều chế cụ thể có quy trình được mô tả trong các Ví dụ hoặc Bước khác. Tỷ lệ phần trăm là khối lượng chỉ khác là hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc trừ khi có chỉ dẫn khác. Các phần và tỷ lệ phần trăm của hỗn hợp dung môi sắc ký là theo thể tích, trừ khi có chỉ dẫn khác. Phổ ^1H NMR được thông báo theo trường thấp ppm từ tetrametylsilan; “s” nghĩa là vạch đơn, “t” nghĩa là vạch ba, “q” nghĩa là vạch bốn, “m” nghĩa là đa vạch, “d” nghĩa là vạch đôi, “dt” nghĩa là vạch đôi của vạch ba, “br s” nghĩa là vạch đơn rộng. Số hợp chất dùng để chỉ các bảng danh mục A-C.

Ví dụ thực hiện sáng chế**Ví dụ tổng hợp 1**

Bước A: Điều chế 1-[[3-xyclopentyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]pyrazol-4-yl]metyl]piperidin-4-carbonitril:

3-xyclopentyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridyl]pyrazol-4-carbaldehyt (100mg, 0,32mmol) được bổ sung vào dung dịch chứa piperidin-4-carbonitril (53mg, 0,48mmol) trong điclometan (10mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 2 giờ, và sau đó natri triaxetoxymetaphorua (170mg, 0,80mmol) được bổ sung trong một phần. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 18 giờ và tiếp theo là được bổ sung vào nước (100mL). Hỗn hợp này được chiết bằng điclometan (3 x 100mL). Phần chiết hữu cơ gom lại được làm khô (MgSO₄), được làm bay hơi dưới áp suất giảm, và phần cặn được tinh chế bằng sắc ký trên silicagel (etyl axetat/hexan) để thu được hợp chất nêu ở đề mục (120 mg), hợp chất theo sáng chế. ¹H NMR (CDCl₃) δ: 8,51 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,30 (m, 1H), 3,42 (s, 2H), 3,17 (p, 1H), 2,59–2,77 (m, 3H), 2,35 (br s, 2H), 1,98–2,09 (m, 2H), 1,79–1,97 (m, 8H), 1,64–1,75 (m, 2H).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế 1-[[3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1H-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril

Bước A: Điều chế 3-(tetrahydro-2-furanyl)-1H-pyrazol

Dung dịch chứa (+/-)-tetrahydrofuran-2-axit carboxylic (10,0 g, 86,2mmol) trong điclometan (100mL) được bổ sung oxalyl clorua (32,84 g, 258,6mmol), tiếp theo là bổ sung vài giọt DMF. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 3 giờ. Chất hữu cơ bay hơi sau đó được loại bỏ dưới áp suất giảm, và phần cặn được hấp thụ trong điclometan (100mL). Dung dịch thu được được bổ sung từng giọt vào hỗn hợp phản ứng lạnh chứa điclometan (100mL), *N,O*-đimetylhydroxylamin (5,26 g, 86,2mmol), và trietylamin (15mL) ở 10°C. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng này được bổ sung vào 200mL nước và được chiết bằng điclometan (3 x 100mL). Phần chiết hữu cơ gom

lại được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và bay hơi được loại bỏ dưới áp suất giảm để thu được sản phẩm trung gian amit được sử dụng trong bước tiếp theo mà không cần tinh chế thêm.

Hợp chất trung gian amit này được hoà tan trong 100mL tetrahydrofuran và methyl magie bromua dung dịch (43,1mL, 2,0 M dung dịch trong THF, 86,2mmol) được bổ sung từng giọt. Hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt đến 40°C trong 8 giờ. Tiếp theo, hỗn hợp phản ứng này được bổ sung vào nước, độ pH được điều chỉnh đến 7 bằng cách bổ sung amoni clorua, và hỗn hợp phản ứng sau đó được chiết bằng diethyl ete (3 x 100mL). Phần chiết hữu cơ gom lại được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và chất hữu cơ dễ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm để thu được phần cặn thô. Phần cặn này được sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng 100% hexan để thu được 1-(tetrahydro-2-furanyl)etanon ở dạng dầu (8,22 g). 1-(tetrahydro-2-furanyl)etanon (8,22 g, 72,1mmol) được bổ sung vào *tert*-butoxy bis(dimethylamino)metan (12,54 g, 72,1mmol) và được gia nhiệt đến 70°C trong 6 giờ. Nguyên liệu dễ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm, phần cặn thu được được pha loãng bằng 100mL etanol, và 20mL hydrazin hydrat được bổ sung. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 24 giờ. Chất hữu cơ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm để thu được hợp chất nêu ở đề mục dưới dạng chất rắn (6,11 g). ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 10,0 (br s, NH), 7,52 (s, 1H), 6,21 (s, 1H), 5,05 (t, 1H), 4,04 (t, 1H), 3,91 (t, 1H), 2,30 (t, 1H), 1,99-2,05 (m, 3H).

Bước B: Điều chế 3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1H-pyrazol

Sản phẩm của Bước A (3,0 g, 21,7mmol) được bổ sung vào dung dịch chứa NaH (869mg, 40% trong dầu khoáng, 21,73mmol) trong DMF (40mL) và được khuấy trong điều kiện khí nitơ. Sau khi khuấy trong 30 phút, 2-flo-4-(triflometyl)pyridin (5,38 g, 32,6mmol) được bổ sung trong một phần, và hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt đến 75°C trong 18 giờ. Hỗn hợp phản ứng sau đó được bổ sung một cách cẩn thận vào nước và được chiết bằng diethyl ete (3 x 100mL). Phần chiết hữu cơ gom lại được rửa một lần bằng nước, được làm khô trên magie

sulfat, được lọc, và chất dễ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô này được sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng hexan/ethyl axetat để thu được sản phẩm nêu ở đề mục (3,13 g). ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 8,54 (d, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,48 (d, 1H) 5,05 (t, 1H), 4,06 (m, 1H), 3,94 (m, 1H), 2,34 (m, 1H), 2,02-2,18 (m, 3H).

Bước C: Điều chế 4-bromo-3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1H-pyrazol

Sản phẩm của Bước B (3,13 g, 11,1mmol) được bổ sung vào pyridin (2,63 g, 33,3mmol) trong 100mL tetrahydrofuran, và brom (5,32 g, 33,3mmol) được bổ sung trong một phần. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 48 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Chất dễ bay hơi sau đó được loại ra dưới áp suất giảm, và phần cặn thô được sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng hexan/ethyl axetat để thu được sản phẩm nêu ở đề mục (4,15 g). ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 8,57 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,40 (d, 1H), 5,09 (t, 1H), 4,15 (t, 1H), 3,97 (t, 1H), 2,04-2,33 (m, 4H).

Bước D: Điều chế 3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1H-pyrazol-4-carboxaldehyt

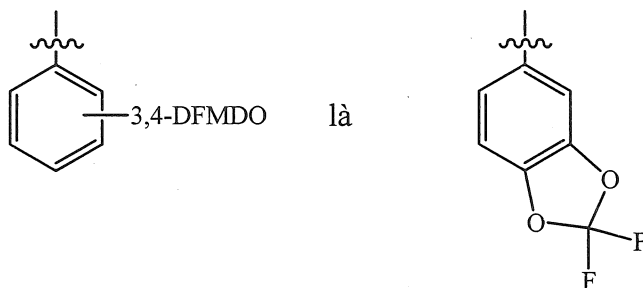
Sản phẩm của Bước C (4,15 g, 11,5mmol) được bổ sung vào 100mL tetrahydrofuran trong điều kiện khí nitơ; hỗn hợp phản ứng được làm nguội đến -78°C , và *n*-butyllithi (4,2mL, 3,0 M trong hexan/tetrahydrofuran, 12,6 mmol) được bổ sung từng giọt. DMF (10mL) sau đó được bổ sung ở -78°C , và phản ứng được làm ấm từ từ đến nhiệt độ trong phòng và được khuấy mạnh qua đêm. Hỗn hợp phản ứng sau đó được bổ sung một cách cẩn thận vào nước và được chiết bằng diethyl ete (3 x 100mL). Các phần chiết ete gom lại được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và chất dễ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm để thu được chất thô. Nguyên liệu này được sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng hexan/ethyl axetat để thu được sản phẩm (0,303 g). ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 10,13 (s,

1H), 9,07 (s, 1H), 8,61 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 5,38 (t, 1H), 3,97-4,00 (m, 1H), 3,64-3,67 (m, 1H), 2,42-2,47 (m, 2H), 2,20-2,25 (m, 2H).

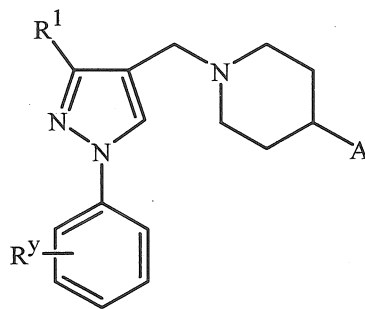
Bước E: Điều chế 1-[[3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1H-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril

Dung dịch chứa sản phẩm của Bước D (0,303 g, 0,974mmol) trong 10mL diclometan được bổ sung 4-xyanopiperidin (1mL). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 30 phút, sau thời gian đó natri triaxetoxyborohyđrua (338mg, 2,14mmol) được bổ sung trong một phần. Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 18 giờ, và sau đó được bổ sung vào dung dịch nước natri bicacbonat dung dịch và được chiết bằng diclometan (3 x 50mL). Phần chiết hữu cơ gom lại được làm khô trên magie sulfat, được lọc, và chất dễ bay hơi được loại ra dưới áp suất giảm để tạo ra sản phẩm thô. Sản phẩm thô này được sắc ký trên silicagel được rửa giải bằng hexan/etyl axetat để thu được hợp chất nêu ở đề mục, hợp chất theo sáng chế (20,5 mg). ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 8,53 (s, 1H), 8,41(d, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,34 (d, 1H), 5,09 (t, 1H), 4,08 (m, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,52 (s, 2H), 2,57-2,78 (m, 3H), 1,80-2,38 (m, 10H).

Bằng các phương pháp được mô tả ở đây cùng với các phương pháp đã biết trong lĩnh vực này, có thể điều chế được các hợp chất trong các Bảng từ 1 đến 6m sau. Các từ viết tắt sau được sử dụng trong Bảng là như sau: Me nghĩa là metyl. 3,4-DFMDO là 3,4-điflometylendioxy như được thể hiện dưới đây:



Bảng 1a



A là xyano

<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>	<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>	<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>
xyclopropyl	4-Me	Xyclopropyl	3-F	xyclopropyl	3-Cl
xyclobutyl	4-Me	Xyclobutyl	3-F	xyclobutyl	3-Cl
xyclopentyl	4-Me	Xyclopentyl	3-F	xyclopentyl	3-Cl
xyclohexyl	4-Me	Xyclohexyl	3-F	xyclohexyl	3-Cl
1-xyclopentenyl	4-Me	1-xyclopentenyl	3-F	1-xyclopentenyl	3-Cl
isopropyl	4-Me	Isopropyl	3-F	isopropyl	3-Cl
1-metylpropyl	4-Me	1-metylpropyl	3-F	1-metylpropyl	3-Cl
1-etylpropyl	4-Me	1-etylpropyl	3-F	1-etylpropyl	3-Cl
tetrahydro-2-furanyl	4-Me	tetrahydro-2-furanyl	3-F	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl
tetrahydro-3-furanyl	4-Me	tetrahydro-3-furanyl	3-F	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	4-Me	1,3-dioxolan-2-yl	3-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl
xyclopropyl	3-Br	xyclopropyl	3-CF ₃	xyclopropyl	3-OCF ₃
xyclobutyl	3-Br	xyclobutyl	3-CF ₃	xyclobutyl	3-OCF ₃
xyclopentyl	3-Br	xyclopentyl	3-CF ₃	xyclopentyl	3-OCF ₃
xyclohexyl	3-Br	xyclohexyl	3-CF ₃	xyclohexyl	3-OCF ₃
1-xyclopentenyl	3-Br	1-xyclopentenyl	3-CF ₃	1-xyclopentenyl	3-OCF ₃
isopropyl	3-Br	isopropyl	3-CF ₃	isopropyl	3-OCF ₃
1-metylpropyl	3-Br	1-metylpropyl	3-CF ₃	1-metylpropyl	3-OCF ₃
1-etylpropyl	3-Br	1-etylpropyl	3-CF ₃	1-etylpropyl	3-OCF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-Br	tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-OCF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-Br	tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-OCF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-Br	1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-OCF ₃
xyclopropyl	4-F	xyclopropyl	4-Cl	xyclopropyl	4-Br
xyclobutyl	4-F	xyclobutyl	4-Cl	xyclobutyl	4-Br
xyclopentyl	4-F	xyclopentyl	4-Cl	xyclopentyl	4-Br
xyclohexyl	4-F	xyclohexyl	4-Cl	xyclohexyl	4-Br
1-xyclopentenyl	4-F	1-xyclopentenyl	4-Cl	1-xyclopentenyl	4-Br
isopropyl	4-F	isopropyl	4-Cl	isopropyl	4-Br
1-metylpropyl	4-F	1-metylpropyl	4-Cl	1-metylpropyl	4-Br
1-etylpropyl	4-F	1-etylpropyl	4-Cl	1-etylpropyl	4-Br
tetrahydro-2-furanyl	4-F	tetrahydro-2-furanyl	4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	4-Br
tetrahydro-3-furanyl	4-F	tetrahydro-3-furanyl	4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	4-Br
1,3-dioxolan-2-yl	4-F	1,3-dioxolan-2-yl	4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	4-Br
xyclopropyl	4-CF ₃	xyclopropyl	4-OCF ₃	xyclopropyl	3-F, 4-F
xyclobutyl	4-CF ₃	xyclobutyl	4-OCF ₃	xyclobutyl	3-F, 4-F

xylopentyl	4-CF ₃	xylopentyl	4-OCF ₃	xylopentyl	3-F, 4-F
xylohexyl	4-CF ₃	xylohexyl	4-OCF ₃	xylohexyl	3-F, 4-F
1-xylopentenyl	4-CF ₃	1-xylopentenyl	4-OCF ₃	1-xylopentenyl	3-F, 4-F
isopropyl	4-CF ₃	isopropyl	4-OCF ₃	isopropyl	3-F, 4-F
1-metylpropyl	4-CF ₃	1-metylpropyl	4-OCF ₃	1-metylpropyl	3-F, 4-F
1-etylpropyl	4-CF ₃	1-etylpropyl	4-OCF ₃	1-etylpropyl	3-F, 4-F
tetrahydro-2-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-F
tetrahydro-3-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-F
1,3-dioxolan-2-yl	4-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-F
xylopropyl	3-F, 4-Cl	xylopropyl	3-F, 4-Br	xylopropyl	3-F, 4-CF ₃
xylobutyl	3-F, 4-Cl	xylobutyl	3-F, 4-Br	xylobutyl	3-F, 4-CF ₃
xylopentyl	3-F, 4-Cl	xylopentyl	3-F, 4-Br	xylopentyl	3-F, 4-CF ₃
xylohexyl	3-F, 4-Cl	xylohexyl	3-F, 4-Br	xylohexyl	3-F, 4-CF ₃
1-xylopentenyl	3-F, 4-Cl	1-xylopentenyl	3-F, 4-Br	1-xylopentenyl	3-F, 4-CF ₃
isopropyl	3-F, 4-Cl	isopropyl	3-F, 4-Br	isopropyl	3-F, 4-CF ₃
1-metylpropyl	3-F, 4-Cl	1-metylpropyl	3-F, 4-Br	1-metylpropyl	3-F, 4-CF ₃
1-etylpropyl	3-F, 4-Cl	1-etylpropyl	3-F, 4-Br	1-etylpropyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-CF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Br	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-CF ₃
xylopropyl	3-F, 4-OCF ₃	xylopropyl	3-Cl, 4-F	xylopropyl	3-Cl, 4-Cl
xylobutyl	3-F, 4-OCF ₃	xylobutyl	3-Cl, 4-F	xylobutyl	3-Cl, 4-Cl
xylopentyl	3-F, 4-OCF ₃	xylopentyl	3-Cl, 4-F	xylopentyl	3-Cl, 4-Cl
xylohexyl	3-F, 4-OCF ₃	xylohexyl	3-Cl, 4-F	xylohexyl	3-Cl, 4-Cl
1-xylopentenyl	3-F, 4-OCF ₃	1-xylopentenyl	3-Cl, 4-F	1-xylopentenyl	3-Cl, 4-Cl
isopropyl	3-F, 4-OCF ₃	isopropyl	3-Cl, 4-F	isopropyl	3-Cl, 4-Cl
1-metylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-metylpropyl	3-Cl, 4-F	1-metylpropyl	3-Cl, 4-Cl
1-etylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-etylpropyl	3-Cl, 4-F	1-etylpropyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-Cl
xylopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	xylopropyl	3-Br, 4-F	xylopropyl	3-CF ₃ , 4-F
xylobutyl	3-Cl, 4-CF ₃	xylobutyl	3-Br, 4-F	xylobutyl	3-CF ₃ , 4-F
xylopentyl	3-Cl, 4-CF ₃	xylopentyl	3-Br, 4-F	xylopentyl	3-CF ₃ , 4-F
xylohexyl	3-Cl, 4-CF ₃	xylohexyl	3-Br, 4-F	xylohexyl	3-CF ₃ , 4-F
1-xylopentenyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-xylopentenyl	3-Br, 4-F	1-xylopentenyl	3-CF ₃ , 4-F
isopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	isopropyl	3-Br, 4-F	isopropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-metylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-metylpropyl	3-Br, 4-F	1-metylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-etylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-etylpropyl	3-Br, 4-F	1-etylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-Br, 4-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-F
xylopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xylopropyl	3,4-DFMDO		

xyclobutyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclobutyl	3,4-DFMDO
xyclopentyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclopentyl	3,4-DFMDO
xyclohexyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclohexyl	3,4-DFMDO
1-xyclopentenyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-xyclopentenyl	3,4-DFMDO
isopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	isopropyl	3,4-DFMDO
1-metylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-metylpropyl	3,4-DFMDO
1-etylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-etylpropyl	3,4-DFMDO
tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3,4-DFMDO
tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3,4-DFMDO
1,3-diioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-Cl	1,3-diioxolan-2-yl	3,4-DFMDO

Bảng 1b

Bảng 1b giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là NHC(O)Me.

Bảng 1c

Bảng 1c giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là CF₃.

Bảng 1d

Bảng 1d giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là C≡CH.

Bảng 1e

Bảng 1e giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là CH=CH₂.

Bảng 1f

Bảng 1f giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là 2-pyridinyl.

Bảng 1g

Bảng 1g giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là 3-pyridinyl.

Bảng 1h

Bảng 1h giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là 2-imidazolyl.

Bảng 1i

Bảng 1i giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Bảng 1j

Bảng 1j giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là NHC(O)OMe.

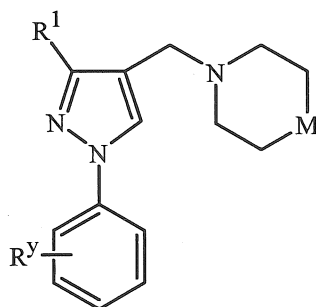
Bảng 1k

Bảng 1k giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là NHC(O)(xyclopropyl).

Bảng 1m

Bảng 1m giống với Bảng 1a, chỉ khác là A là NHC(O)N(Me)₂.

Bảng 2a



M là O

<u>R¹</u>	<u>R_Y</u>
Xyclopropyl	4-Me
Xyclobutyl	4-Me
Xyclopentyl	4-Me
Xyclohexyl	4-Me
1-xyclopentenyl	4-Me
Isopropyl	4-Me
1-metylpropyl	4-Me
1-etylpropyl	4-Me
tetrahydro-2-furanyl	4-Me
tetrahydro-3-furanyl	4-Me
1,3-dioxolan-2-yl	4-Me
Xyclopropyl	3-Br
Xyclobutyl	3-Br
Xyclopentyl	3-Br
Xyclohexyl	3-Br
1-xyclopentenyl	3-Br
Isopropyl	3-Br
1-metylpropyl	3-Br
1-etylpropyl	3-Br
tetrahydro-2-furanyl	3-Br
tetrahydro-3-furanyl	3-Br
1,3-dioxolan-2-yl	3-Br
Xyclopropyl	4-F
Xyclobutyl	4-F
Xyclopentyl	4-F
Xyclohexyl	4-F
1-xyclopentenyl	4-F
Isopropyl	4-F
1-metylpropyl	4-F
1-etylpropyl	4-F
tetrahydro-2-furanyl	4-F
tetrahydro-3-furanyl	4-F
1,3-dioxolan-2-yl	4-F
Xyclopropyl	4-CF ₃

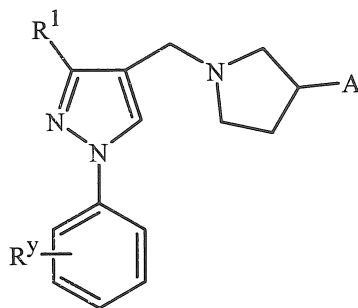
<u>R¹</u>	<u>R_Y</u>
xyclopropyl	3-F
xyclobutyl	3-F
xyclopentyl	3-F
xyclohexyl	3-F
1-xyclopentenyl	3-F
isopropyl	3-F
1-metylpropyl	3-F
1-etylpropyl	3-F
tetrahydro-2-furanyl	3-F
tetrahydro-3-furanyl	3-F
1,3-dioxolan-2-yl	3-F
xyclopropyl	3-CF ₃
xyclobutyl	3-CF ₃
xyclopentyl	3-CF ₃
xyclohexyl	3-CF ₃
1-xyclopentenyl	3-CF ₃
isopropyl	3-CF ₃
1-metylpropyl	3-CF ₃
1-etylpropyl	3-CF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃
xyclopropyl	4-Cl
xyclobutyl	4-Cl
xyclopentyl	4-Cl
xyclohexyl	4-Cl
1-xyclopentenyl	4-Cl
isopropyl	4-Cl
1-metylpropyl	4-Cl
1-etylpropyl	4-Cl
tetrahydro-2-furanyl	4-Cl
tetrahydro-3-furanyl	4-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	4-Cl
xyclopropyl	4-OCF ₃

<u>R¹</u>	<u>R_Y</u>
xyclopropyl	3-Cl
xyclobutyl	3-Cl
xyclopentyl	3-Cl
xyclohexyl	3-Cl
1-xyclopentenyl	3-Cl
isopropyl	3-Cl
1-metylpropyl	3-Cl
1-etylpropyl	3-Cl
tetrahydro-2-furanyl	3-Cl
tetrahydro-3-furanyl	3-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl
xyclopropyl	3-OCF ₃
xyclobutyl	3-OCF ₃
xyclopentyl	3-OCF ₃
xyclohexyl	3-OCF ₃
1-xyclopentenyl	3-OCF ₃
isopropyl	3-OCF ₃
1-metylpropyl	3-OCF ₃
1-etylpropyl	3-OCF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-OCF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-OCF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-OCF ₃
xyclopropyl	4-Br
xyclobutyl	4-Br
xyclopentyl	4-Br
xyclohexyl	4-Br
1-xyclopentenyl	4-Br
isopropyl	4-Br
1-metylpropyl	4-Br
1-etylpropyl	4-Br
tetrahydro-2-furanyl	4-Br
tetrahydro-3-furanyl	4-Br
1,3-dioxolan-2-yl	4-Br
xyclopropyl	3-F, 4-F

Xyclobutyl	4-CF ₃	xyclobutyl	4-OCF ₃	xyclobutyl	3-F, 4-F
Xyclopentyl	4-CF ₃	xyclopentyl	4-OCF ₃	xyclopentyl	3-F, 4-F
Xyclohexyl	4-CF ₃	xyclohexyl	4-OCF ₃	xyclohexyl	3-F, 4-F
1-xyclopentenyl	4-CF ₃	1-xyclopentenyl	4-OCF ₃	1-xyclopentenyl	3-F, 4-F
Isopropyl	4-CF ₃	isopropyl	4-OCF ₃	isopropyl	3-F, 4-F
1-methylpropyl	4-CF ₃	1-methylpropyl	4-OCF ₃	1-methylpropyl	3-F, 4-F
1-ethylpropyl	4-CF ₃	1-ethylpropyl	4-OCF ₃	1-ethylpropyl	3-F, 4-F
tetrahydro-2-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-F
tetrahydro-3-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-F
1,3-dioxolan-2-yl	4-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-F
Xyclopropyl	3-F, 4-Cl	xyclopropyl	3-F, 4-Br	xyclopropyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclobutyl	3-F, 4-Cl	xyclobutyl	3-F, 4-Br	xyclobutyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclopentyl	3-F, 4-Cl	xyclopentyl	3-F, 4-Br	xyclopentyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclohexyl	3-F, 4-Cl	xyclohexyl	3-F, 4-Br	xyclohexyl	3-F, 4-CF ₃
1-xyclopentenyl	3-F, 4-Cl	1-xyclopentenyl	3-F, 4-Br	1-xyclopentenyl	3-F, 4-CF ₃
Isopropyl	3-F, 4-Cl	isopropyl	3-F, 4-Br	isopropyl	3-F, 4-CF ₃
1-methylpropyl	3-F, 4-Cl	1-methylpropyl	3-F, 4-Br	1-methylpropyl	3-F, 4-CF ₃
1-ethylpropyl	3-F, 4-Cl	1-ethylpropyl	3-F, 4-Br	1-ethylpropyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-CF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Br	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-CF ₃
Xyclopropyl	3-F, 4-OCF ₃	xyclopropyl	3-Cl, 4-F	xyclopropyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclobutyl	3-F, 4-OCF ₃	xyclobutyl	3-Cl, 4-F	xyclobutyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclopentyl	3-F, 4-OCF ₃	xyclopentyl	3-Cl, 4-F	xyclopentyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclohexyl	3-F, 4-OCF ₃	xyclohexyl	3-Cl, 4-F	xyclohexyl	3-Cl, 4-Cl
1-xyclopentenyl	3-F, 4-OCF ₃	1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-F	1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-Cl
Isopropyl	3-F, 4-OCF ₃	isopropyl	3-Cl, 4-F	isopropyl	3-Cl, 4-Cl
1-methylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-methylpropyl	3-Cl, 4-F	1-methylpropyl	3-Cl, 4-Cl
1-ethylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-ethylpropyl	3-Cl, 4-F	1-ethylpropyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-Cl
Xyclopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	xyclopropyl	3-Br, 4-F	xyclopropyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclobutyl	3-Cl, 4-CF ₃	xyclobutyl	3-Br, 4-F	xyclobutyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclopentyl	3-Cl, 4-CF ₃	xyclopentyl	3-Br, 4-F	xyclopentyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclohexyl	3-Cl, 4-CF ₃	xyclohexyl	3-Br, 4-F	xyclohexyl	3-CF ₃ , 4-F
1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-xyclopentenyl	3-Br, 4-F	1-xyclopentenyl	3-CF ₃ , 4-F
Isopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	isopropyl	3-Br, 4-F	isopropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-methylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-methylpropyl	3-Br, 4-F	1-methylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-ethylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-ethylpropyl	3-Br, 4-F	1-ethylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-Br, 4-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-F

Xyclopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclopropyl	3,4-DFMDO
Xyclobutyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclobutyl	3,4-DFMDO
Xyclopentyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclopentyl	3,4-DFMDO
Xyclohexyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclohexyl	3,4-DFMDO
1-xyclopentenyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-xyclopentenyl	3,4-DFMDO
Isopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	isopropyl	3,4-DFMDO
1-metylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-metylpropyl	3,4-DFMDO
1-etylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-etylpropyl	3,4-DFMDO
tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3,4-DFMDO
tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3,4-DFMDO
1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	3,4-DFMDO

Bảng 3a



A là NHC(O)Me

<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>
Xyclopropyl	4-Me
Xyclobutyl	4-Me
Xyclopentyl	4-Me
Xyclohexyl	4-Me
1-xyclopentenyl	4-Me
Isopropyl	4-Me
1-metylpropyl	4-Me
1-etylpropyl	4-Me
tetrahydro-2-furanyl	4-Me
tetrahydro-3-furanyl	4-Me
1,3-dioxolan-2-yl	4-Me
Xyclopropyl	3-Br
Xyclobutyl	3-Br
Xyclopentyl	3-Br
Xyclohexyl	3-Br
1-xyclopentenyl	3-Br
Isopropyl	3-Br
1-metylpropyl	3-Br
1-etylpropyl	3-Br
tetrahydro-2-furanyl	3-Br
tetrahydro-3-furanyl	3-Br

<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>
xyclopropyl	3-F
xyclobutyl	3-F
xyclopentyl	3-F
xyclohexyl	3-F
1-xyclopentenyl	3-F
Isopropyl	3-F
1-metylpropyl	3-F
1-etylpropyl	3-F
tetrahydro-2-furanyl	3-F
tetrahydro-3-furanyl	3-F
1,3-dioxolan-2-yl	3-F
Xyclopropyl	3-CF ₃
Xyclobutyl	3-CF ₃
Xyclopentyl	3-CF ₃
Xyclohexyl	3-CF ₃
1-xyclopentenyl	3-CF ₃
Isopropyl	3-CF ₃
1-metylpropyl	3-CF ₃
1-etylpropyl	3-CF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃

<u>R¹</u>	<u>R^Y</u>
xyclopropyl	3-Cl
xyclobutyl	3-Cl
xyclopentyl	3-Cl
xyclohexyl	3-Cl
1-xyclopentenyl	3-Cl
isopropyl	3-Cl
1-metylpropyl	3-Cl
1-etylpropyl	3-Cl
tetrahydro-2-furanyl	3-Cl
tetrahydro-3-furanyl	3-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl
xyclopropyl	3-OCF ₃
xyclobutyl	3-OCF ₃
xyclopentyl	3-OCF ₃
xyclohexyl	3-OCF ₃
1-xyclopentenyl	3-OCF ₃
isopropyl	3-OCF ₃
1-metylpropyl	3-OCF ₃
1-etylpropyl	3-OCF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-OCF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-OCF ₃

1,3-dioxolan-2-yl	3-Br	1,3-dioxolan-2-yl	3-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-OCF ₃
Xyclopropyl	4-F	Xyclopropyl	4-Cl	xyclopropyl	4-Br
Xyclobutyl	4-F	Xyclobutyl	4-Cl	xyclobutyl	4-Br
Xyclopentyl	4-F	Xyclopentyl	4-Cl	xyclopentyl	4-Br
Xyclohexyl	4-F	Xyclohexyl	4-Cl	xyclohexyl	4-Br
1-xyclopentenyl	4-F	1-xyclopentenyl	4-Cl	1-xyclopentenyl	4-Br
Isopropyl	4-F	Isopropyl	4-Cl	isopropyl	4-Br
1-methylpropyl	4-F	1-methylpropyl	4-Cl	1-methylpropyl	4-Br
1-ethylpropyl	4-F	1-ethylpropyl	4-Cl	1-ethylpropyl	4-Br
tetrahydro-2-furanyl	4-F	tetrahydro-2-furanyl	4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	4-Br
tetrahydro-3-furanyl	4-F	tetrahydro-3-furanyl	4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	4-Br
1,3-dioxolan-2-yl	4-F	1,3-dioxolan-2-yl	4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	4-Br
Xyclopropyl	4-CF ₃	Xyclopropyl	4-OCF ₃	xyclopropyl	3-F, 4-F
Xyclobutyl	4-CF ₃	Xyclobutyl	4-OCF ₃	xyclobutyl	3-F, 4-F
Xyclopentyl	4-CF ₃	Xyclopentyl	4-OCF ₃	xyclopentyl	3-F, 4-F
Xyclohexyl	4-CF ₃	Xyclohexyl	4-OCF ₃	xyclohexyl	3-F, 4-F
1-xyclopentenyl	4-CF ₃	1-xyclopentenyl	4-OCF ₃	1-xyclopentenyl	3-F, 4-F
Isopropyl	4-CF ₃	Isopropyl	4-OCF ₃	isopropyl	3-F, 4-F
1-methylpropyl	4-CF ₃	1-methylpropyl	4-OCF ₃	1-methylpropyl	3-F, 4-F
1-ethylpropyl	4-CF ₃	1-ethylpropyl	4-OCF ₃	1-ethylpropyl	3-F, 4-F
tetrahydro-2-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-F
tetrahydro-3-furanyl	4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-F
1,3-dioxolan-2-yl	4-CF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-F
Xyclopropyl	3-F, 4-Cl	Xyclopropyl	3-F, 4-Br	xyclopropyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclobutyl	3-F, 4-Cl	Xyclobutyl	3-F, 4-Br	xyclobutyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclopentyl	3-F, 4-Cl	Xyclopentyl	3-F, 4-Br	xyclopentyl	3-F, 4-CF ₃
Xyclohexyl	3-F, 4-Cl	Xyclohexyl	3-F, 4-Br	xyclohexyl	3-F, 4-CF ₃
1-xyclopentenyl	3-F, 4-Cl	1-xyclopentenyl	3-F, 4-Br	1-xyclopentenyl	3-F, 4-CF ₃
Isopropyl	3-F, 4-Cl	Isopropyl	3-F, 4-Br	isopropyl	3-F, 4-CF ₃
1-methylpropyl	3-F, 4-Cl	1-methylpropyl	3-F, 4-Br	1-methylpropyl	3-F, 4-CF ₃
1-ethylpropyl	3-F, 4-Cl	1-ethylpropyl	3-F, 4-Br	1-ethylpropyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-CF ₃
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-Br	tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-CF ₃
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Cl	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-Br	1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-CF ₃
Xyclopropyl	3-F, 4-OCF ₃	Xyclopropyl	3-Cl, 4-F	xyclopropyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclobutyl	3-F, 4-OCF ₃	Xyclobutyl	3-Cl, 4-F	xyclobutyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclopentyl	3-F, 4-OCF ₃	xyclopentyl	3-Cl, 4-F	xyclopentyl	3-Cl, 4-Cl
Xyclohexyl	3-F, 4-OCF ₃	Xyclohexyl	3-Cl, 4-F	xyclohexyl	3-Cl, 4-Cl
1-xyclopentenyl	3-F, 4-OCF ₃	1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-F	1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-Cl
Isopropyl	3-F, 4-OCF ₃	Isopropyl	3-Cl, 4-F	isopropyl	3-Cl, 4-Cl
1-methylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-methylpropyl	3-Cl, 4-F	1-methylpropyl	3-Cl, 4-Cl
1-ethylpropyl	3-F, 4-OCF ₃	1-ethylpropyl	3-Cl, 4-F	1-ethylpropyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-2-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-Cl
tetrahydro-3-furanyl	3-F, 4-OCF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-Cl
1,3-dioxolan-2-yl	3-F, 4-OCF ₃	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-F	1,3-dioxolan-2-yl	3-Cl, 4-Cl

Xyclopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	Xyclopropyl	3-Br, 4-F	xyclopropyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclobutyl	3-Cl, 4-CF ₃	Xyclobutyl	3-Br, 4-F	xyclobutyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclopentyl	3-Cl, 4-CF ₃	Xyclopentyl	3-Br, 4-F	xyclopentyl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclohexyl	3-Cl, 4-CF ₃	Xyclohexyl	3-Br, 4-F	xyclohexyl	3-CF ₃ , 4-F
1-xyclopentenyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-xyclopentenyl	3-Br, 4-F	1-xyclopentenyl	3-CF ₃ , 4-F
Isopropyl	3-Cl, 4-CF ₃	Isopropyl	3-Br, 4-F	isopropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-metylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-metylpropyl	3-Br, 4-F	1-metylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
1-etylpropyl	3-Cl, 4-CF ₃	1-etylpropyl	3-Br, 4-F	1-etylpropyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-2-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-2-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
tetrahydro-3-furanyl	3-Cl, 4-CF ₃	tetrahydro-3-furanyl	3-Br, 4-F	tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-F
1,3-đioxolan-2-yl	3-Cl, 4-CF ₃	1,3-đioxolan-2-yl	3-Br, 4-F	1,3-đioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-F
Xyclopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	xyclopropyl	3,4-DFMDO		
Xyclobutyl	3-CF ₃ , 4-Cl	Xyclobutyl	3,4-DFMDO		
Xyclopentyl	3-CF ₃ , 4-Cl	Xyclopentyl	3,4-DFMDO		
Xyclohexyl	3-CF ₃ , 4-Cl	Xyclohexyl	3,4-DFMDO		
1-xyclopentenyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-xyclopentenyl	3,4-DFMDO		
Isopropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	Isopropyl	3,4-DFMDO		
1-metylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-metylpropyl	3,4-DFMDO		
1-etylpropyl	3-CF ₃ , 4-Cl	1-etylpropyl	3,4-DFMDO		
tetrahydro-2-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-2-furanyl	3,4-DFMDO		
tetrahydro-3-furanyl	3-CF ₃ , 4-Cl	tetrahydro-3-furanyl	3,4-DFMDO		
1,3-đioxolan-2-yl	3-CF ₃ , 4-Cl	1,3-đioxolan-2-yl	3,4-DFMDO		

Bảng 3b

Bảng 3b giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là NHC(O)(xyclopropyl).

Bảng 3c

Bảng 3c giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là NHC(O)N(Me)₂.

Bảng 3d

Bảng 3d giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là NHC(O)OMe.

Bảng 3e

Bảng 3e giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là xyano.

Bảng 3f

Bảng 3f giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là CF₃.

Bảng 3g

Bảng 3g giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là C≡CH.

Bảng 3h

Bảng 3h giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là CH=CH₂.

Bảng 3i

Bảng 3i giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là 2-pyridinyl.

Bảng 3j

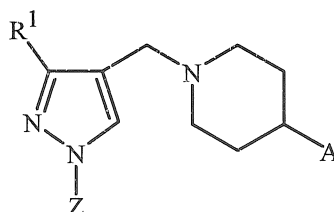
Bảng 3j giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là 3-pyridinyl.

Bảng 3k

Bảng 3k giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là 2-imidazolyl.

Bảng 3m

Bảng 3m giống với Bảng 3a, chỉ khác là A là 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Bảng 4aA là xyano

<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyridinyl	xylobutyl	4,5-điclo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xylobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-clo-2-pyridinyl	xylobutyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-bromo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-bromo-2-pyridinyl	xylobutyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-2-pyridinyl	xylobutyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-flo-2-pyridinyl	xylobutyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	xylobutyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-metyl-2-pyridinyl	xylobutyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopropyl	2-naphtalenyl	xylobutyl	2-naphtalenyl
Xyclopropyl	2-isoquinolinyl	xylobutyl	2-isoquinolinyl
Xyclopentyl	4,5-điclo-2-pyridinyl	xylohexyl	4,5-điclo-2-pyridinyl

Xyclopentyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-clo-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-bromo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-bromo-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-flo-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-metyl-2-pyridinyl	xyclohexyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopentyl	2-naphtalenyl	xyclohexyl	2-naphtalenyl
Xyclopentyl	2-isoquinolinyl	xyclohexyl	2-isoquinolinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	isopropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-bromo-2-pyridinyl	isopropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-bromo-2-pyridinyl	isopropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-flo-2-pyridinyl	isopropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-metyl-2-pyridinyl	isopropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	2-naphtalenyl	isopropyl	2-naphtalenyl
1-xyclopentenyl	2-isoquinolinyl	isopropyl	2-isoquinolinyl

1-methylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-flo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-methylpropyl	2-naphtalenyl	1-ethylpropyl	2-naphtalenyl
1-methylpropyl	2-isoquinolinyl	1-ethylpropyl	2-isoquinolinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-clo-2-pyridinyl

furanyl		furanyl	
tetrahydro-2-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	2-naphtalenyl	tetrahydro-3-furanyl	2-naphtalenyl
tetrahydro-2-furanyl	2-isoquinolinyl	tetrahydro-3-furanyl	2-isoquinolinyl
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-điclo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-bromo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-bromo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-flo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-metyl-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	2-naphtalenyl		
1,3-dioxolan-2-yl	2-isoquinolinyl		

Bảng 4b

Bảng 4b giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là NHC(O)Me.

Bảng 4c

Bảng 4c giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là CF₃.

Bảng 4d

Bảng 4d giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là $C\equiv CH$.

Bảng 4e

Bảng 4e giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là $CH=CH_2$.

Bảng 4f

Bảng 4f giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là 2-pyridinyl.

Bảng 4g

Bảng 4g giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là 3-pyridinyl.

Bảng 4h

Bảng 4h giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là 2-imidazolyl.

Bảng 4i

Bảng 4i giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là 1,3,4-oxadiazol-2-yl.

Bảng 4j

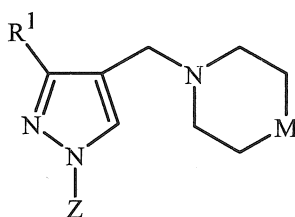
Bảng 4j giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là $NHC(O)OMe$.

Bảng 4k

Bảng 4k giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là $NHC(O)(xyclopropyl)$.

Bảng 4m

Bảng 4m giống với Bảng 4a, chỉ khác là A là $NHC(O)N(Me)_2$.

Bảng 5aM là O

<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4,5-điclo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl

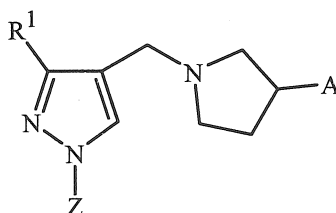
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xyclobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-bromo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-bromo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-flo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-metyl-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopropyl	2-naphtalenyl	xyclobutyl	2-naphtalenyl
Xyclopropyl	2-isoquinolinyl	xyclobutyl	2-isoquinolinyl
Xyclopentyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	xcyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-clo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-bromo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-bromo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-flo-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	xcyclohexyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-metyl-2-pyridinyl	xcyclohexyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopentyl	2-naphtalenyl	xcyclohexyl	2-naphtalenyl
Xyclopentyl	2-isoquinolinyl	xcyclohexyl	2-isoquinolinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	Isopropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl

1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	Isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-clo-2-pyridinyl	Isopropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-bromo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-bromo-2-pyridinyl	Isopropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-2-pyridinyl	Isopropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-flo-2-pyridinyl	Isopropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	Isopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-metyl-2-pyridinyl	Isopropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	2-naphtalenyl	Isopropyl	2-naphtalenyl
1-xyclopentenyl	2-isoquinolinyl	Isopropyl	2-isoquinolinyl
1-metylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-clo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-clo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-flo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl	1-etylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-metylpropyl	2-naphtalenyl	1-etylpropyl	2-naphtalenyl
1-metylpropyl	2-isoquinolinyl	1-etylpropyl	2-isoquinolinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl

tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	2-naphtalenyl	tetrahydro-3-furanyl	2-naphtalenyl
tetrahydro-2-furanyl	2-isoquinolinyl	tetrahydro-3-furanyl	2-isoquinolinyl
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-diclo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-bromo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-bromo-2-pyridinyl		

1,3-đioxolan-2-yl	4-clo-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	5-flo-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	5-metyl-2-pyridinyl
1,3-đioxolan-2-yl	2-naphtalenyl
1,3-đioxolan-2-yl	2-isoquinolinyl

Bảng 6a



A là xyano

<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4,5-điclo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	Xyclobutyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	Xyclobutyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-bromo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-bromo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-clo-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-flo-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclobutyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopropyl	5-metyl-2-pyridinyl	xyclobutyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopropyl	2-naphtalenyl	xyclobutyl	2-naphtalenyl
Xyclopropyl	2-isoquinolinyl	xyclobutyl	2-isoquinolinyl
Xyclopentyl	4,5-điclo-2-pyridinyl	xyclohexyl	4,5-điclo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4,5-điclo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	xyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl

Xyclopentyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	cyclohexyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	cyclohexyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	cyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	cyclohexyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	cyclohexyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
Xyclopentyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-clo-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-bromo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-bromo-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-bromo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-clo-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-clo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-flo-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-flo-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	cyclohexyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
Xyclopentyl	5-metyl-2-pyridinyl	cyclohexyl	5-metyl-2-pyridinyl
Xyclopentyl	2-naphtalenyl	cyclohexyl	2-naphtalenyl
Xyclopentyl	2-isoquinolinyl	cyclohexyl	2-isoquinolinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	isopropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	isopropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	isopropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-clo-2-pyridinyl	isopropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-bromo-2-pyridinyl	isopropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-bromo-2-pyridinyl	isopropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-clo-2-pyridinyl	isopropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-flo-2-pyridinyl	isopropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	isopropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	5-metyl-2-pyridinyl	isopropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-xyclopentenyl	2-naphtalenyl	isopropyl	2-naphtalenyl
1-xyclopentenyl	2-isoquinolinyl	isopropyl	2-isoquinolinyl
1-metylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-metylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-etylpropyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl

1-methylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	1-ethylpropyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
1-methylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-bromo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-bromo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-clo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-clo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-flo-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-flo-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
1-methylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl	1-ethylpropyl	5-metyl-2-pyridinyl
1-methylpropyl	2-naphtalenyl	1-ethylpropyl	2-naphtalenyl
1-methylpropyl	2-isoquinolinyl	1-ethylpropyl	2-isoquinolinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-bromo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-bromo-2-pyridinyl

tetrahydro-2-furanyl	4-clo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-clo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-flo-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-flo-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl	tetrahydro-3-furanyl	5-metyl-2-pyridinyl
tetrahydro-2-furanyl	2-naphtalenyl	tetrahydro-3-furanyl	2-naphtalenyl
tetrahydro-2-furanyl	2-isoquinoliny	tetrahydro-3-furanyl	2-isoquinoliny
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-diclo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-diclo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-(OCF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4,5-bis(CF ₃)-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(OCF ₃)-5-clo-2-pyrimidinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-flo-5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-bromo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-bromo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-clo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-flo-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-(OCF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	4-(CF ₃)-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	5-metyl-2-pyridinyl		
1,3-dioxolan-2-yl	2-naphtalenyl		
1,3-dioxolan-2-yl	2-isoquinoliny		

Bảng 6b

Bảng 6b giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là NHC(O)Me.

Bảng 6c

Bảng 6c giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là CF₃.

Bảng 6d

Bảng 6d giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là C≡CH.

Bảng 6e

Bảng 6e giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là $\text{CH}=\text{CH}_2$.

Bảng 6f

Bảng 6f giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là 2-pyridinyl.

Bảng 6g

Bảng 6g giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là 3-pyridinyl.

Bảng 6h

Bảng 6h giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là 2-imidazolyl.

Bảng 6i

Bảng 6i giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là 1.3.4-oxadiazol-2-yl.

Bảng 6j

Bảng 6j giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là NHC(O)OMe .

Bảng 6k

Bảng 6k giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là $\text{NHC(O)(xyclopropyl)}$.

Bảng 6m

Bảng 6m giống với Bảng 6a, chỉ khác là A là NHC(O)N(Me)_2 .

Hợp chất theo sáng chế thường được sử dụng làm hoạt chất trong chế phẩm phòng trừ loài gây hại không xương sống, tức là thành phần, với ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, dùng làm chất mang. Các thành phần của chế phẩm hoặc hỗn hợp được chọn phù hợp với các tính chất lý học của hoạt chất, kiểu dùng và các yếu tố môi trường như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Dạng pha chế hữu ích bao gồm cả chế phẩm dạng lỏng và chế phẩm dạng rắn. Chế phẩm dạng lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương-huyền phù) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Dạng chế phẩm lỏng chứa nước thông thường là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, chất cô đặc dễ chảy và nhũ tương-huyền phù. Dạng chế phẩm lỏng không chứa nước thường là

dạng cô đặc dễ nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

Chế phẩm dạng rắn thông thường là dạng bột mịn để rắc khô, bột, hạt, viên tròn, viên tròn, viên hình thoi, viên nén, dạng màng bao (chứa các lớp phủ hạt) và các dạng tương tự, có thể dễ phân tán trong nước (“thấm ướt”) hoặc tan trong nước. Các lớp màng và lớp phủ được tạo ra từ các dung dịch tạo màng hoặc huyền phù dễ chảy đặc biệt hữu ích dùng để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao (vi) nang và còn được tạo thành hỗn dịch hoặc chế phẩm rắn; theo cách khác, toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc “được bao”). Việc bao nang này có thể kiểm soát hoặc làm chậm quá trình giải phóng hoạt chất. Hạt dễ nhũ hóa kết hợp được các ưu điểm của cả chế phẩm dạng cô đặc dễ nhũ hóa lẫn chế phẩm dạng hạt khô. Các chế phẩm đậm đặc được sử dụng chủ yếu làm chất trung gian dùng để pha chế tiếp.

Chế phẩm dạng phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Các chế phẩm lỏng và rắn như vậy được bào chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước, nhưng đôi khi là môi trường thích hợp khác như hydrocacbon thơm hoặc parafin hoặc dầu thực vật. Lượng dung dịch để phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thông thường là nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Các chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng. Các chế phẩm lỏng và rắn có thể được đưa lên thực vật hạt làm chất xử lý hạt trước khi gieo trồng để bảo vệ rễ đang phát triển và các bộ phận khác dưới mặt đất của thực vật và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thụ nội hấp.

Chế phẩm thường chứa lượng hữu hiệu của hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong khoảng gần đúng sau đây để tổng lượng là 100 phần trăm khối lượng.

Phần trăm khối lượng			
	<u>Hoạt chất</u>	<u>Chất pha</u>	<u>Chất hoạt động</u>
		<u>loãng</u>	<u>bề mặt</u>
Hạt, viên nén và bột dễ hòa tan trong nước và dễ phân tán trong nước	0,001–90	0–99,999	0–15
Thê phân tán dạng dầu, huyền phù, nhũ tương, dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa)	1–50	40–99	0–50
Bột mịn để rắc khô	1–25	70–99	0–5
Hạt và viên tròn	0,001–99	5–99,999	0–15
Chế phẩm có độ bền cao	90–99	0–10	0–2

Chất pha loãng rắn bao gồm, ví dụ, đất sét như bentonit, montmorillonit, attapulgit và kaolan, thạch cao, xenluloza, titan đioxit, kẽm oxit, tinh bột, dextrin, đường (ví dụ, lactoza, sucroza), silic oxit, bột talc, mica, đất tảo silic, ure, canxi cacbonat, natri cacbonat và bicarbonat, và natri sulfat. Chất pha loãng rắn thông thường được mô tả trong Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Chất pha loãng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-đimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-đimetylformamit), limonen, đimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyrrolidôn (ví dụ, *N*-metylpyrrolidinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen cacbonat, butylen cacbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, hydrocacbon thơm, chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridecyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như este lactat alkylat hóa, este đibazơ và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-etylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodecyllic, isoocadecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu tridecyllic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, rượu điaxeton và rượu benzylic. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không

bão hoà (thường là có 6 đến 22 nguyên tử cacbon), như dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ, dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ, mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng lỏng cũng bao gồm các axit béo được alkylat hóa (ví dụ, được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng chưng cất. Chất pha loãng lỏng thông thường được mô tả trong Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Chế phẩm rắn và lỏng theo sáng chế thường chứa một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt thường biến đổi, thường làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Tùy thuộc vào bản chất của các nhóm ưa nước và ưa chất béo trong phân tử chất hoạt động bề mặt, có thể sử dụng chất hoạt động bề mặt làm chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hoá hoặc chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại thành dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu dụng đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: rượu alkoxylat như rượu alkoxylat trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit được etoxylat hóa; triglyxerit được alkoxylat hóa như đậu tương được etoxylat hóa, dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, đinonyl phenol etoxylat và đodexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); polyme khối được điều chế từ etylen oxit hoặc propylen oxit và các polyme khối ngược, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen oxit; các axit béo etoxylat hóa; các este béo và các dầu được etoxylat hóa; các metyl este được etoxylat hóa; tristyrilphenol được etoxylat hóa (bao gồm các loại được điều chế từ etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất trên cơ sở mỡ lợn cừu, các este polyetoxylat như các este

sorbitan axit béo được polyetoxy hoá, các este sorbitol axit béo được polyetoxy hoá và các este glyxerol axit béo được polyetoxy hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyl (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở silicon; và dẫn xuất của đường như các este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysaccarit.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu dụng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và các muối của chúng; rượu được carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất diphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc succinic hoặc các anhydrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của rượu alkoxylat, các este phosphat của alkylphenol alkoxylat và các este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt trên cơ sở protein; các dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol được etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu được etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N,N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và đodexyl và tridexylbenzen; các sulfonat của naphtalen được ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cắt phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và các dẫn xuất của chúng như các muối dialkyl sulfosuccinat.

Chất hoạt động bề mặt cation hữu dụng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các amit và các amit được etoxylat hóa; các amin như *N*-alkyl propandiamin, tripropylentriamin và dipropylentetramin, và các amin được etoxylat hóa, các điamin được etoxylat hóa và các amin được propoxylat hóa (được điều chế từ các amin và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các muối amin như amin axetat và các muối điamin; các muối amoni bậc bốn như muối bậc bốn, các muối bậc bốn và các muối được tạo bậc bốn hai lần được etoxylat hóa; và amin oxit như alkylđimetylamin oxit và bis-(2-hydroxyetyl)-alkylamin oxit.

Cũng hữu dụng đối với các chế phẩm theo sáng chế là hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa hỗn hợp chất hỗ trợ và chất phụ gia, đã biết đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực làm chất trợ điều chế (một số chất trong số chất này có thể được xem là hoạt động chức năng như chất pha loãng rắn, chất pha loãng lỏng và chất hoạt động bề mặt). Chất hỗ trợ và chất phụ gia như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (chất đệm), hiện tượng tạo bọt trong quá trình xử lý (chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), hiện tượng lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong đồ chứa (chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (chất chống đông), màu sắc (chất phân tán tạo màu/thuốc nhuộm), hiện tượng rửa trôi (chất tạo màng hoặc chất dính), sự bay hơi (chất làm chậm bay hơi), và các hiện tượng khác tương tự. Chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat, rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và sáp. Ví dụ về chất hỗ trợ và chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm chất được liệt kê trong *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và Bắc Mỹ do McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; và Công bố đơn PCT số WO 03/024222.

Hợp chất có công thức 1 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được đưa vào các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với

nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc để nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2,000 μm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới 3 μm . Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem, U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để thu được hạt phân tán trong nước. Các chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10 μm . Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem, Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và sau đó, và WO 91/13546. Dạng viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các phương pháp điều chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" trong *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Cũng xem trong U.S. 3,235,361, cột 6, dòng 16 đến cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, dòng 43 đến cột 7, dòng 62 và các Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến cột 5, dòng 17 và các Ví dụ 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and

Sons, Inc., New York, 1961, trang 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

Trong các ví dụ sau, tất cả các chế phẩm đều được điều chế theo cách thông thường. Số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong Bảng phụ lục A–F. Không cần mô tả kỹ hơn, các tác giả sáng chế cho rằng người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng phần mô tả trên của sáng chế với phạm vi rộng nhất. Do đó, các ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh họa sáng chế và không giới hạn phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Phần trăm được tính theo khối lượng trừ khi có quy định khác.

Ví dụ A

Chất cô đặc có độ bền cao

Hợp chất 23	98,5%
gel sol khí của silic oxit	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%

Ví dụ B

Bột thấm ướt

Hợp chất 25	65,0%
đodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
montmorillonit (nung)	23,0%

Ví dụ C

Hạt

Hợp chất 26	10,0%
atapulgit hạt (chất có khả năng bay hơi kém, 0,71/0,30 mm; sàng rây Mỹ có kích cỡ lỗ)	90,0%

Ví dụ D

Viên tròn ép đùn

Hợp chất 38	25,0%
-------------	-------

natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtathủy tinh thểulfonat	1,0%
Canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ EDạng cô đặc có thể nhũ hóa

Hợp chất 39	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
Metyl este của axit béo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ví dụ FVi nhũ tương

Hợp chất 40	5,0%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	30,0%
Alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
Nước	20,0%

Ví dụ GXử lý hạt

Hợp chất 43	20,00%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	5,00%
montan axit sáp	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%
polyoxyetylen/polyoxypropylen copolyme khối	1,00%
stearyl rượu (POE 20)	2,00%
Polyorganosilane	0,20%
thuốc nhuộm đỏ	0,05%
nước	65,75%

Ví dụ HPhân bón dạng lỏng

Hợp chất 46	2,5%
-------------	------

copolyme pyrrolidon-styren	4,8%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,3%
Bột talc	0,8%
ngô tinh bột	5,0%
phân bón giải phóng chậm	36,0%
Kao lanh	38,0%
Nước	10,6%

Ví dụ Ihuyền phù đặc

Hợp chất 48	35%
Copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
Copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
Chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
Nước	53,7%

Ví dụ JNhũ tương trong nước

Hợp chất 54	10,0%
Copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
Copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
Chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon nền dầu mỏ thơm	20,0
Nước	58,7%

Ví dụ KChất phân tán dạng dầu

Hợp chất 65	25%
polyoxyetylen sorbitol hexaoleat	15%
đất sét bentonit được cải biến về mặt hữu cơ	2,5%
metyl este của axit béo	57,5%

Ví dụ LNhũ tương huyền phù

Hợp chất 66	10,0%
Imidacloprit	5,0%
Copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
Copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
Chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon nền dầu mỏ thơm	20,0%
Nước	53,7%

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đối với phổ rộng của loài gây hại không xương sống. Các loài gây hại này bao gồm các loài không xương sống sống trong nhiều môi trường như, ví dụ, cây lá, rễ, đất, cây thu hoạch hoặc các loại thực phẩm khác, các công trình xây dựng hoặc da động vật. Các loài gây hại này bao gồm, ví dụ, loài không xương sống ăn lá (bao gồm lá, thân, hoa và quả), hạt, gỗ, sợi dệt hoặc máu hoặc mô động vật và nhờ đó gây ra tổn thương hoặc hư hại cho, ví dụ, đang phát triển hoặc bảo quản cây nông nghiệp, cây lâm nghiệp, cây trong nhà kính, cây cảnh, cây trong vườn ươm, bảo quản các loại thực phẩm hoặc các sản phẩm sợi hoặc các công trình xây dựng và các công trình khác hoặc các bộ phận của chúng hoặc gây hại cho sức khỏe động vật hoặc sức khỏe cộng đồng. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này cần hiểu rằng không phải tất cả các

hợp chất đều hữu hiệu như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả loài gây hại.

Vì vậy, chế phẩm theo sáng chế có thể sử dụng trong nông nghiệp để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật và cả trong lĩnh vực phi nông nghiệp để bảo vệ cây trong vườn và cây khác khỏi loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Tính hữu ích này bao gồm bảo vệ cây trồng và các cây khác (tức là cả trong lĩnh vực nông nghiệp lẫn phi nông nghiệp) chứa nguyên liệu di truyền được đưa vào bằng kỹ thuật di truyền (tức là chuyển gen) hoặc được cải biến bằng cách gây đột biến để thu được các tính trạng có lợi. Ví dụ về các tính trạng này gồm tính chống chịu với thuốc diệt cỏ, tính đề kháng với loài gây hại ăn thực vật (ví dụ, các côn trùng, ve bét, các loài rệp cây, nhện, giun tròn, ốc sên, nấm gây bệnh thực vật, vi khuẩn và virus), cải biến sự phát triển thực vật, tăng tính chống chịu với các điều kiện sinh trưởng bất lợi như các nhiệt độ cao hoặc thấp, độ ẩm của đất cao hoặc thấp, và độ muối cao, tăng đơm hoa hoặc kết quả, tăng hiệu suất thu hoạch, tăng thời gian chín, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, và cải thiện các đặc tính bảo quản hoặc chế biến sản phẩm thu hoạch. Thực vật chuyển gen có thể được cải biến để biểu hiện nhiều tính trạng. Ví dụ về thực vật có các tính trạng được tạo ra bằng kỹ thuật di truyền hoặc gây đột biến gồm các giống ngô, bông, đậu tương và khoai tây biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* trừ sâu như YIELD GARD^d, KNOCKOUT^d, STARLINK^d, BOLLGARD^d, NuCOTN^d and NEWLEAF^d, INVICTA RR2 PROTM và các giống ngô, bông, đậu tương và cải dầu chống chịu thuốc diệt cỏ như ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® và CLEARFIELD®, cũng như cây trồng biểu hiện N-acetyltransferase (GAT) có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ glyphosat, hoặc cây trồng chứa gen HRA có tính chống chịu với thuốc diệt cỏ ức chế acetylactat syntase (ALS). Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với tính trạng được tạo ra bởi kỹ thuật di truyền hoặc được biến đổi bằng cách đột biến, vì vậy làm tăng sự biểu hiện kiểu hình hoặc một cách hữu hiệu của tính trạng hoặc làm tăng tác dụng phòng trừ loài gây hại không xương sống một cách hữu hiệu của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế. Cụ thể là, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác theo kiểu hiệp đồng với sự

biểu hiện kiểu hình của các protein hoặc các sản phẩm tự nhiên khác gây độc cho loài gây hại không xương sống để thu được tác dụng phòng trừ lớn hơn hỗ trợ của loài gây hại này.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể tùy ý chứa chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi, magie, sắt, đồng, bo, mangan, kẽm và molybden. Tốt hơn là, chế phẩm bao gồm ít nhất một phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh, canxi và magie. Chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật có thể ở dạng chất lỏng hoặc chất rắn. Tốt hơn là, chế phẩm rắn ở dạng hạt, dạng thoi nhỏ hoặc dạng viên nén. Chế phẩm rắn bao gồm phân bón có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất hoặc hỗn hợp theo sáng chế với phân bón cùng với các thành phần điều chế và sau đó điều chế chế phẩm bằng các phương pháp như tạo hạt hoặc ép đùn. Theo cách khác, chế phẩm rắn có thể được điều chế bằng cách phun dung dịch hoặc huyền phù chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trong dung môi dễ bay hơi lên phân bón đã điều chế trước ở dạng hỗn hợp ổn định về kích thước, ví dụ, dạng hạt, dạng thoi nhỏ hoặc dạng viên nén, và sau đó làm bay hơi dung môi.

Ứng dụng phi nông nghiệp dùng để chỉ việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong phạm vi không phải cây trồng. Việc ứng dụng phi nông nghiệp của chế phẩm theo sáng chế bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong bảo quản hạt, hột và các loại thực phẩm khác và trong hàng dệt như quần áo và thảm. ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong cây trang trí, cây lâm nghiệp, trong hàng rào, dọc lề đường và đường xe lửa và khu vực có cỏ như bãi cỏ, sân gôn và đồng cỏ. ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại không xương sống trong nhà ở và công trình kiến trúc khác có thể được sử dụng bởi người, trang trại, gia súc, vườn bách thú hoặc các động vật khác. Ứng dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm việc phòng trừ loài gây hại

như mối có thể làm hư hại gỗ hoặc các vật liệu xây dựng khác được sử dụng trong các công trình.

Ứng dụng phi nông nghiệp của chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm bảo vệ người và sức khoẻ động vật bằng cách phòng trừ loài gây hại không xương sống sống ký sinh hoặc truyền bệnh truyền nhiễm. Việc phòng trừ động vật ký sinh bao gồm phòng trừ loài ký sinh bên ngoài là loài ký sinh trên bề mặt cơ thể của vật chủ (ví dụ, vai, nách, bụng, phần bên trong của đùi) và loài ký sinh bên trong ký sinh bên trong cơ thể của vật chủ (ví dụ, dạ dày, ruột, phổi, tĩnh mạch, dưới da, mô bạch huyết). loài gây hại ký sinh bên ngoài hoặc truyền bệnh bao gồm, ví dụ, bọ chét chig-ger, ve, chấy, muỗi, ruồi, bét và bọ chét. Loài ký sinh bên trong bao gồm heartgiun, giun móc và giun sán. Chế phẩm theo sáng chế thích hợp để phòng trừ sự quấy phá hoặc nhiễm loài ký sinh toàn thân và/hoặc không toàn thân trên các động vật. Chế phẩm theo sáng chế là đặc biệt thích hợp để chống lại loài gây hại ký sinh bên ngoài hoặc truyền bệnh. Chế phẩm theo sáng chế thích hợp để chống lại loài ký sinh quấy phá hoạt động nông nghiệp của các động vật, như gia súc, cừu, dê, ngựa, lợn, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, gà, gà tây, vịt, ngỗng và ong; động vật làm cảnh và động vật nuôi như chó, mèo, chim cảnh và cá cảnh; cũng như các động vật thử nghiệm như chuột đồng, chuột lang, chuột và chuột nhắt. Bằng cách chống lại các loài ký sinh này, mức tác động có hại và mức giảm đặc tính (đặc biệt là đặc tính về thịt, sữa, len, da, trứng, mật ong, v.v..) được giảm, vì vậy có thể áp dụng chế phẩm theo sáng chế kinh tế hơn và làm đơn giản việc nuôi các động vật.

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp hoặc phi nông nghiệp bao gồm: trứng, ấu trùng và con trưởng thành thuộc bộ Cánh vảy như sâu cắn gié, sâu cắn rễ, sâu đo và sâu hại bông thuộc họ Bướm đêm (ví dụ, sâu đục thân màu hồng (*Sesamia inferens* Walker), sâu đục thân ngô (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), sâu cắn gié phương nam (*Spodoptera eridania* Cramer), sâu cắn gié lá (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), sâu cắn gié củ cải đường (*Spodoptera exigua* Hübner), sâu cắn lá bông (*Spodoptera littoralis* Boisduval), sâu cắn gié sọc vàng (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), sâu cắn rễ đen (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), sâu bướm đậu nhung (*Anticarsia gemmatilis* Hübner),

sâu đục quả xanh (*Lithophane antennata* Walker), sâu cắn gié cải bắp (*Barathra brassicae* Linnaeus), sâu đo đậu tương (*Pseudoplusia includens* Walker), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Hübner), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Huber), sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens* Fabricius)); sâu đục thân, sâu kén, sâu kéo màng, sâu ốc chớp, sâu cải bắp và sâu gặm thịt lá thuộc họ sâu đục thân (ví dụ, sâu đục ngô châu Âu (*Ostrinia Nubilalis* Hübner), sâu cam rôn (*Amyelois transitella* Walker), sâu kéo màng rế ngô (*Crambus caliginosellus* Clemens), sâu kéo màng cỏ (Pyralidae: *Crambinae*) cũng như sâu kéo màng cỏ (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); sâu đục thân mía (*Chilo infuscatellus* Snellen), đục thân cà chua nhỏ (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), sâu cuốn lá màu xanh (*Cnaphalocerus medinalis*), sâu cuốn lá nhỏ (*Desmia funeralis* Hübner), sâu dừa (*Diaphania nitidalis* Stoll), ấu trùng cải bắp (*Hellula hydralis* Guenée), sâu đục thân màu vàng (*Scirpophaga incertulas* Walker), sâu đục thân rế (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), sâu đục thân trắng (*Scirpophaga innotata* Walker), sâu đục thân rế (*Scirpophaga nivella* Fabricius), sâu đục thân lúa đầu đen (*Chilo polychrysus* Meyrick), sâu bướm cụm cải bắp (*Crociodolomia binotalis* English)); sâu cuốn lá, sâu đục chồi, sâu hạt, và sâu trái cây thuộc họ Tortricidae (ví dụ, bướm cá tuyết (*Cydia pomonella* Linnaeus), bướm hại nho (*Endopiza viteana* Clemens), bướm trái cây phương đông (*Grapholita molta* Busck)); ngài roi chanh cam (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), sâu đục thân chanh cam (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), sâu cuốn lá băng đỏ (*Argyrotaenia velutinana* Walker), sâu cuốn lá dải chéo (*Choristoneura rosaceana* Harris), sâu táo màu nâu nhạt (*Epiphyas postvittana* Walker), ngài nho châu Âu (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), ngài búp táo (*Pandemis pyrusana* Kearfott), sâu cuốn lá ăn tạp (*Platynota stultana* Walsingham), sâu ăn phần hoa sọc vằn (*Pandemis cerasana* Hübner), sâu ăn phần hoa táo màu nâu (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); và nhiều loài thuộc bộ Cánh vảy có ảnh hưởng về mặt kinh tế khác (ví dụ, bướm lưng kim cương (*Plutella xylostella* Linnaeus), sâu hồng hại bông (*Pectinophora gossypiella* Saunders), bướm gipsy (*Lymkiénria dispar* Linnaeus)); đục thân quả đào (*Carposina niponensis* Walsingham), sâu đục thân cành con đào (*Anarsia lineatella* Zeller), sâu củ khoai tây (*Phthorimaea*

operculella Zeller), đục lá chấm (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), sâu đục lá táo châu á (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), sâu cuốn lá lúa (*Lerodea eufala* Edwards), sâu đục lá táo (*Leucoptera scitella* Zeller)); trứng, nhộng và sâu trưởng thành thuộc bộ Cánh gián bao gồm gián thuộc các họ Blattellidae và Blattidae (ví dụ, gián phương Đông (*Blatta orientalis* Linnaeus), gián châu á (*Blattella asahinai* Mizukubo), gián Đức (*Blattella germanica* Linnaeus), gián sọc nâu (*Supella longipalpa* Fabricius), gián Mỹ (*Periplaneta americana* Linnaeus), gián nâu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gián Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), gián nâu khói (*Periplaneta fuliginosa* Service), gián Australia (*Periplaneta australasiae* Fabr.), gián tôm hùm (*Nauphoeta cinerea* Olivier) và gián trơn (*Symploce pallens* Stephens)); trứng, ấu trùng và dạng trưởng thành ăn lá, ăn quả, ăn rễ, ăn hạt và ăn mô bột thuộc bộ Cánh cứng bao gồm một ngũ cốc thuộc họ Anthribidae, Bruchidae, và Curculionidae (ví dụ, bộ vòi voi hại bông (*Anthonomus grandis* Boheman), bộ vòi voi hại lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), một ngũ cốc thóc (*Sitophilus granarius* Linnaeus), một ngũ cốc gạo (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), một ngũ cốc cỏ poa thường niên (*Listronotus maculicollis* Dietz), một vòi dài cỏ poa (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), một vòi dài săn mồi (*Sphenophorus venatus vestitus*), một vòi dài Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); bộ nhảy, bộ cánh cứng dựa chuột, sâu ăn rễ, bộ cánh cứng lá cây, bộ cánh cứng khoai tây, và sâu đục lá thuộc họ Chrysomelidae (ví dụ, bộ cánh cứng khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), sâu ăn rễ ngô phương Đông (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); bộ da và các loài bộ cánh cứng khác thuộc họ Scarabaeidae (ví dụ, bộ cánh cứng Nhật Bản (*Popillia japonica* Newman), bộ cánh cứng phương Đông (*Anomala orientalis* Waterhouse), *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), bộ da mặt nạ phương Bắc (*Cyclocephala borealis* Arrow), bộ da mặt nạ phương Nam (*Cyclocephala immaculata* Olivier hoặc *C. lurida* Bland), bộ phân và giò trắng (*Aphodius* spp.), bộ cỏ đen (*Ataenius spretulus* Haldeman), bộ cánh cứng xanh June (*Cotinis nitida* Linnaeus), bộ cánh cứng vườn Châu á (*Maladera castanea* Arrow), bộ cánh cứng May/June (*Phyllophaga* spp.) và bộ da châu Âu (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); bộ cánh cứng thảm thuộc họ Dermestidae;

sâu ăn lá thuộc họ Elateridae; bộ cánh cứng vỏ cây thuộc họ Scolytidae và bộ cánh cứng bột mỳ thuộc họ Tenebrionidae.

Ngoài ra, các loài gây hại nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm: trứng, dạng trưởng thành và ấu trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm sâu tai thuộc họ Forficulidae (ví dụ, sâu tai châu Âu (*Forficula auricularia* Linnaeus), sâu tai đen (*Chelisoches mono* Fabricius)); trứng, dạng chưa thành thực, dạng trưởng thành và nhộng thuộc các bộ Cánh nửa cứng và Cánh giống như rệp cây thuộc họ Miridae, ve sầu thuộc họ Cicadidae, rầy xanh đuôi đen (ví dụ *Empoasca* spp.) thuộc họ Cicadellidae, rệp (Ví dụ, *Cimex lectularius* Linnaeus) thuộc họ Cimicidae, rầy thuộc các họ Fulgoroidae và Delphacidae, ve sầu nhảy cây thuộc họ Membracidae, rệp lá thuộc họ Psyllidae, ruồi trắng thuộc họ Aleyrodidae, rệp thuộc họ rệp Aphididae, rệp sáp thuộc họ Phylloxeridae, rệp sáp thuộc họ Pseudococcidae, rệp cây thuộc họ Coccidae, Diaspididae và Margarodidae, rệp vằn thuộc họ Tingidae, rệp hôi thuộc họ Pentatomidae, rệp (ví dụ, rệp lông (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) và rệp phương Nam (*Blissus insularis* Barber)) và rệp hại hạt khác thuộc họ Lygaeidae, rệp dãi thuộc họ Cercopidae, rệp hại bí thuộc họ Coreidae, và rệp đỏ và nhuộm màu bông thuộc họ Pyrrhocoridae.

Các loài gây hại cũng bao gồm trứng, ấu trùng, nhộng và dạng trưởng thành thuộc bộ Ve bét (ve) như bộ ve nhện và bộ ve đỏ thuộc họ Tetranychidae (ví dụ, bộ ve đỏ Châu Âu (*Panonychus ulmi* Koch), bộ ve nhện hai chấm (*Tetranychus urticae* Koch), bộ ve McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), bộ ve dẹt thuộc họ Tenuipalpidae (ví dụ, bộ ve dẹt hại chanh (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), bộ ve ăn chồi và gỉ sắt thuộc họ Eriophyidae và các loại bộ ve ăn lá và ve bét ảnh hưởng đến sức khỏe của người và động vật, tức là ve bét phấn hoa thuộc họ Epidermoptidae, ve bét quả đại thuộc họ Demodicidae, ve bét hạt cứng thuộc họ Glycyphagidae, ve thuộc họ Ixodidae, thường được gọi là ve cứng (ví dụ, ve nhỏ (*Ixodes scapularis* Say), ve gây liệt úc (*Ixodes holocyclus* Neumann), ve chó Mỹ (*Dermacentor variabilis* Say), tíc sao (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) và ve thuộc họ Argasidae, thường được gọi là ve mềm (ví dụ, ve tái phát (*Ornithodoros turicata*), ve gà nói chung (*Argas Radiatus*)); ve bét gây nấm vảy và ngứa thuộc các họ Psoroptidae, Pyemotidae, và Sarcoptidae; trứng, dạng

trưởng thành và dạng chưa thành thực thuộc bộ Cánh thẳng bao gồm châu chấu và đê (ví dụ, châu chấu di cư (ví dụ, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), châu chấu Mỹ (ví dụ, *Schistocerca americana* Drury), châu chấu sa mạc (*Schistocerca Gregaria* Forskal), châu chấu di cư (*Locusta migratoria* Linnaeus), châu chấu bụi rậm (*Zonocerus* spp.), đê nhà (*Acheta domesticus* Linnaeus), đê ruồi (ví dụ, đê ruồi hung (*Scapteriscus vicinus* Scudder) và đê ruồi phương Nam (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); các dạng trưởng thành và dạng chưa thành thực thuộc bộ côn trùng Hai cánh bao gồm sâu đục lá, ruồi nhướ, ruồi quả (Tephritidae), ruồi frít (ví dụ, *Oscinella frit* Linnaeus), giòi đất, ruồi nhà (ví dụ, *Musca domestica* Linnaeus), ruồi nhà nhỏ (ví dụ, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), ruồi chó (ví dụ, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), ruồi mặt, ruồi anten, ruồi nhặng (ví dụ, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), và các loài ruồi rêu khác, ruồi trâu (ví dụ, *Tabanus* spp.), ruồi giòi (ví dụ, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), bộ gia súc (ví dụ, *Hypoderma* spp.), ruồi hươu (ví dụ, *Chrysops* spp.), con mòng (ví dụ, *Melophagus ovinus* Linnaeus) và các loài Râu ngắn khác, muỗi (ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), ruồi đen (ví dụ, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), ruồi nhướ đốt, ruồi cát, sciarids, và các loài Giun tròn khác; trứng, dạng chưa thành thực và dạng trưởng thành thuộc bộ Cánh tơ bao gồm bộ trĩ hành (*Bộ trĩ tabaci* Lindeman), bộ trĩ hại hoa (*Frankliniella* spp.), và các loài bộ trĩ ăn lá khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh màng bao gồm kiến thuộc họ Formicidae bao gồm kiến đục gỗ Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), (ví dụ, kiến đục gỗ màu đỏ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), kiến đục gỗ màu đen (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), kiến chân trắng (*Technomyrmex albipes* French. Smith), kiến đầu to (*Pheidole* sp.), kiến ma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); kiến Pharaoh (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), kiến lửa con (*Wasmannia auropunctata* Roger), kiến lửa (*Solenopsis geminata* Fabricius), kiến lửa đỏ (*Solenopsis invicta* Buren), kiến Achentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), kiến đại (*Paratrechina longicomis* Latreille), kiến mặt đường (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), kiến đậu đũa Trung Quốc (*Lasius alienus* Förster), kiến nhà có mùi (*Tapinoma sessile* Say). Các loại Cánh màng khác bao gồm ong (bao gồm ong đục gỗ), ong sừng, ong bắp

cày vàng và đen, ong bắp cày, và ong cắn lá (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Cánh đều bao gồm mỗi thuộc họ Termitidae (ví dụ, *Macrotermes* sản phẩm. *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (ví dụ, *Cryptotermes* sp.), và họ Rhinotermitidae (ví dụ, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), mối đất phương Đông (*Reticulitermes flavipes* Kollar), mối đất phương Tây (*Reticulitermes hesperus* Banks), mối đất Formosan (*Coptotermes formosanus* Shiraki), mối gỗ Tây ấn Độ (*Incisitermes immigrans* Snyder), mối chuyển bột (*Cryptotermes brevis* Walker), mối gỗ (*Incisitermes snyderi* Light), mối đất Đông Nam (*Reticulitermes virginicus* Banks), mối gỗ phương Đông (*Incisitermes minor* Hagen), mối cây như *Nasutitermes* sp. và các loài mối khác có ảnh hưởng về mặt kinh tế; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Thysanura như bộ bạc (*Lepisma saccharina* Linnaeus) và firebrat (*Theimobia domestica* Packard); các loài gây hại côn trùng thuộc bộ ăn lông và gồm chấy đầu (*Pediculus humanus capitis* De Geer), rận người (*Pediculus humanus* Linnaeus), rận gà (*Menacanthus stramineus* Nitsch), rận chó (*Trichodectes canis* De Geer), rận chim (*Goniocotes gallinae* De Geer), rận cừu (*Bovicola ovis* Schrank), rận gia súc mũi ngắn (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), rận gia súc mũi dài (*Linognathus vituli* Linnaeus) và rận ký sinh hút và cắn người và động vật khác; các loài gây hại côn trùng thuộc bộ Siphonoptera bao gồm rầy chuột phương Đông (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), rầy mèo (*Ctenocephalides felis* Bouche), rầy chó (*Ctenocephalides canis* Curtis), rầy gà mái (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), rầy dích (*Echidnophaga gallinacea* Westgö), rầy người (*Pulex irritans* Linnaeus) và các loài rầy khác gây đau động vật có vú và chim. Các loài động vật chân khớp gây hại khác còn bao gồm: nhện thuộc bộ Nhện như nhện nâu ẩn dật (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) và nhện độc đen Mỹ (*Latrodectus mactans* Fabricius), và rết thuộc bộ có Vảy như rết nhà (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ví dụ về các loài gây hại không xương sống cho hạt bảo quản bao gồm larger grain borer (*Prostephanus truncatus*), lesser grain borer (*Rhyzopertha dominica*), bọ vòi voi gạo (*Stiophilus oryzae*), bọ vòi voi cây ngô (*Stiophilus zeamais*), bọ vòi voi đậu đũa (*Callosobruchus maculatus*), red bột mì bọ cánh

cứng (*Tribolium castaneum*), bọ vôi voi thóc (*Strophilus granarius*), bướm đêm Ấn độ (*Plodia interpunctella*), Mediterranean bọ cánh cứng bột mì (*Ephestia kuhniella*) và bọ cánh cứng hạt nhãn và hạt gỉ sắt (*Cryptolestis ferrugineus*).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc lớp giun tròn, sán dây, sán lá và giun đầu móc bao gồm các loài có ảnh hưởng về mặt kinh tế thuộc bộ Strongylida, bộ Giun đũa, Giun kim, Rhabditida, Spirurida và Enoplida như, nhưng không chỉ giới hạn ở, các loài gây hại nông nghiệp có ảnh hưởng về mặt kinh tế (tức là giun tròn nốt sần thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus*, v...v.) và các loài gây hại cho sức khỏe của người và động vật (tức là tất cả các loài sán lá, sán xơ mít, và giun tròn có ảnh hưởng về mặt kinh tế như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara cards* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis* Leidy ở chó, *Anoplocephala perfoliata* ở ngựa, *Fasciola hepatica* Linnaeus ở động vật nhai lại, v...v.).

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đặc biệt tốt đối với các động vật gây hại thuộc bộ Cánh vảy (ví dụ, *Alabama argillacea* Hilbner (sâu lá bông), *Archips argyrospila* Walker (sâu cuốn lá cây ăn quả), *A. rosana* Linnaeus (sâu cuốn lá châu Âu) và các loài sâu cuốn lá lạc đầu đen khác, *Chilo suppressalis* Walker (sâu đục rễ lúa), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (sâu cuốn lá lúa), *Crambus caliginosellus* Clemens (sâu kéo màng rễ ngô), *Crambus teterrellus* Zincken (sâu kéo màng cỏ poa), *Cydia pomonella* Linnaeus (sâu bướm đục trái), *Earias insulana* Boisduval (sâu xanh có gai), *Earias vittella* Fabricius (sâu xanh có đốm), *Helicoverpa armigera* Hübner (sâu xanh Mỹ), *Helicoverpa zea* Boddie (sâu xanh ngô), *Heliothis virescens* Fabricius (sâu đục chồi thuốc lá), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sâu kéo màng cỏ), *Lobesia botrana* Denis & Schifferrmüller (bướm đêm nho), *Pectinophora gossypiella* Saunders (sâu xanh cắn chướng), *Phyllocnistis citrella* Stainton (sâu đục lá cam quýt), *Pieris brassicae* Linnaeus (bướm lợn trắng lớn Anh), *Pieris rapae* Linnaeus (bướm lợn trắng nhỏ Anh), *Plutella xylostella* Linnaeus (sâu tơ), *Spodoptera exigua* Hübner (sâu cắn gié củ cải đường), *Spodoptera litura* Fabricius (sâu cắn rễ thuốc lá, sâu róm), *Spodoptera*

frugiperda J. E. Smith (sâu cắn gié lá), *Trichoplusia ni* Hübner (sâu đo cải bắp) và *Tuta absoluta* Meyrick (sâu đục lá cà chua).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đáng kể với các loài thuộc bộ côn trùng Cánh giống bao gồm: *Acyrtosiphon pisum* Harris (rệp vùng đậu Hà lan), *Aphis craccivora* Koch (rệp vùng đậu đũa), *Aphis fabae* Scopoli (rệp vùng gỗ cứng), *Aphis gossypii* Glover (rệp vùng bông, rệp vùng dưa), *Aphis pomi* De Geer (rệp vùng táo), *Aphis spiraeola* Patch (rệp vùng mơ trên châu), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (rệp vùng cây mao địa hoàng), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (rệp vùng dâu tây), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (rệp vùng lúa mì Nga), *Dysaphis plikiénaginea* Paaserini (rệp vùng táo đỏ), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (rệp vùng táo lông tơ), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (rệp vùng mận hột), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (rệp vùng củ cải), *Metopolophium dirrhodum* Walker (rệp vùng ngũ cốc), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (rệp vùng khoai tây), *Myzus persicae* Sulzer (rệp vùng khoai tây-đào, rệp vùng đào xanh), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (rệp vùng rau diếp), *Pemphigus* spp. (các loài rệp rế và các loài rệp vú lá), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (rệp vùng lá ngô), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (rệp vùng anh đào), *Schizaphis graminum* Rondani (rệp xanh lỗ cõy), *Sitobion avenae* Fabricius (rệp vùng hại Anh), *Therioaphis maculata* Buckton (rệp vùng cỏ linh lăng có đốm), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (rệp vùng cam quýt đen), và *Toxoptera citricida* Kirkaldy (rệp vùng cam quýt nâu); *Adelges* spp. (adelgids); *Phylloxera devastatrix* Pergande (rệp hại hồ đào pécán); *Bemisia tabaci* Gennadius (ruồi trắng thuốc lá, ruồi trắng khoai lang), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (ruồi trắng cây dương lá rụng), *Dialeurodes citri* Ashmead (ruồi trắng cam quýt) và *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (ruồi trắng nhà kính); *Empoasca fabae* Harris (bọ nhảy hại lá khoai tây), *Laodelphax striatellus* Fallen (rầy nâu nhỏ), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (rầy xanh đuôi đen cúc tây), *Nephotettix cincticeps* Uhler (rầy xanh đuôi đen), *Nephotettix nigropictus* Stal (rầy xanh đuôi đen hại lúa), *Nilaparvata lugens* Stål (rầy nâu), *Peregrinus maidis* Ashmead (bọ nhảy hại cây ngô), *Sogatella furcifera* Horvath (rầy lưng trắng), *Sogatodes orizicola* Muir (rầy lúa), *Typhlocyba pomaria* McAtee (rầy xanh đuôi đen táo trắng), *Erythroneura*

spp. (rầy xanh đuôi đen nhỏ); *Magacidada septendecim* Linnaeus (ve sầu); *Icerya purchasi* Maskell (rệp đốm bông), *Quadraspidotus perniciosus* Comstock (rệp San Jose); *Planococcus citri* Risso (sâu ăn bột cam quýt); *Pseudococcus* spp. (các loài sâu ăn bột khác); *Cacopsylla pyricola* Foerster (rệp lá lê), *Trioza diospyri* Ashmead (rệp lá cây hồng vàng).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc bộ Cánh nửa cứng bao gồm: *Acrostemum hilare* Say (rệp hôi xanh), *Anasa tristis* De Geer (rệp bí), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (rệp), *Cimex lectularius* Linnaeus (rệp) *Corythuca gossypii* Fabricius (rệp bông), *Cyrtopeltis modesta* Distkiển (rệp cà chua), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (bọ xít bông), *Euchistus servus* Say (rệp hôi nâu), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (rệp hôi một đốm), *Graptosthetus* spp. (các loài rệp hại hạt), *Leptoglossus corculus* Say (rệp hạt thông nhảy lá), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (rệp cây), *Nezara viridula* Linnaeus (rệp hôi xanh phương Nam), *Oebalus pugnax* Fabricius (rệp hôi gạo), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (rệp cây cho dịch nhựa mủ lớn), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (bọ nhảy bông). Các bộ côn trùng khác được phòng trừ bởi các chế phẩm theo sáng chế gồm bộ Cánh tơ (ví dụ, *Frankliniella occidentalis* Pergande (bọ trĩ hại hoa phượng Tây), *Scirtothrips citri* Moulton (bọ trĩ cam quýt), *Sericothrips variabilis* Beach (bọ trĩ đậu tương), và *Thrips tabaci* Lindeman (bọ trĩ hành); và bộ Cánh cứng (ví dụ, *Leptinotarsa decemlineata* Say (bọ cánh cứng khoai tây Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (bọ cánh cứng đậu Mexicô) và bộ bọ củi thuộc giống *Agriotes*, *Athous* hoặc *Limonius*).

Cũng cần lưu ý một số hệ phân loại đương thời đối với bộ Cánh giống dưới dạng bộ phụ trong bộ Cánh nửa.

Tốt hơn là sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ trĩ hoa phượng Tây (*Frankliniella occidentalis*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ nhảy hại lá khoai tây (*Empoasca fabae*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ bọ nhảy hại cây ngô (*Peregrinus maidis*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp vùng bông dưa (*Aphis gossypii*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ

sâu tơ (*Plutella xylostella*). Tốt hơn là, sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ sâu cắn gié lá (*Spodoptera frugiperda*).

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể hữu ích để làm tăng sức sống của cây trồng. Phương pháp này bao gồm bước cho cây trồng (ví dụ, tán lá, hoa, quả hoặc rễ) hoặc hạt mà từ đó cây trồng được phát triển tiếp xúc với hợp chất có công thức 1 với lượng đủ để đạt được tác dụng tăng sức sống thực vật mong muốn (tức là lượng hữu hiệu về mặt sinh học). Thông thường, hợp chất có công thức 1 được dùng dưới dạng chế phẩm được pha chế. Mặc dù hợp chất có công thức 1 thường được dùng trực tiếp lên cây trồng hoặc hạt của nó, nó cũng có thể được dùng vào vị trí của cây trồng, tức là môi trường của cây trồng, cụ thể là phần môi trường đủ gần để cho phép hợp chất có công thức 1 thâm nhập vào cây trồng. Vị trí liên quan đến phương pháp này hầu hết thường là môi trường sinh trưởng (tức là môi trường cung cấp chất dinh dưỡng cho cây trồng), thông thường là đất, trong đó cây trồng phát triển. Do đó, xử lý cây trồng để làm tăng sức sống của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt mà từ đó cây trồng phát triển hoặc vị trí của cây trồng tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất có công thức 1.

Việc sức sống của cây trồng tăng lên có thể mang lại một hoặc nhiều hiệu quả quan sát được như sau: (a) tối ưu thiết lập cây trồng được chứng minh bằng tỷ lệ nảy mầm hạt, tỷ lệ mọc của cây và tính chống chịu của cây mỹ mãn; (b) tăng mức sinh trưởng của cây trồng được chứng minh bằng tốc độ phát triển nhanh và khỏe của lá (ví dụ, đo được bằng hệ số diện tích lá), độ cao của cây, số chồi (ví dụ, đối với lúa), khối lượng rễ và tổng khối lượng khô của phần sinh dưỡng của cây trồng; (c) tăng năng suất vụ mùa được chứng minh bằng thời gian ra hoa, khoảng thời gian ra hoa, số lượng hoa, tổng khối lượng sinh khối tích tụ (tức là năng suất về số lượng) và/hoặc khả năng tiêu thụ quả hoặc hạt của sản phẩm (tức là năng suất về chất lượng); (d) tăng khả năng chống chịu hoặc ngăn ngừa sự lây nhiễm bệnh nhiễm khuẩn ở thực vật và sự tàn phá của loài gây hại chân đốt, giun tròn hoặc động vật thân mềm; và (e) tăng khả năng chống chịu của thực vật đối với các sức ép của môi trường như tiếp xúc với nhiệt độ cao, độ ẩm gần điểm cực thuận hoặc các hóa chất gây độc thực vật.

Hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của cây trồng đã được xử lý so với cây trồng không được xử lý bằng cách tiêu diệt hoặc bằng cách khác ngăn ngừa việc ăn thực vật của các loài gây hại không xương sống trong môi trường của cây trồng. Khi không kiểm soát được việc loài gây hại không xương sống ăn cây trồng, các loài gây hại này sẽ làm giảm sức sống của cây trồng bằng cách ăn các mô hoặc nhựa của cây trồng, hoặc truyền mầm bệnh thực vật như virus. Ngay cả khi không có các loài gây hại không xương sống ăn thực vật, các hợp chất theo sáng chế cũng có thể làm tăng sức sống của cây trồng bằng cách làm thay đổi quá trình trao đổi chất của cây trồng. Nói chung, sức sống của cây trồng gần như được tăng đáng kể nhờ xử lý cây trồng bằng hợp chất theo sáng chế nếu cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường không lý tưởng, tức là môi trường có một hoặc nhiều yếu tố bất lợi cho cây trồng để đạt được tiềm năng gen hoàn chỉnh trong môi trường lý tưởng.

Đáng chú ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường bao gồm các loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Tốt hơn là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường không bao gồm các loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Tốt hơn là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng được sinh trưởng trong môi trường chứa lượng ẩm thấp hơn lý tưởng để hỗ trợ cho sự sinh trưởng của cây trồng. Đáng chú ý là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là lúa. Tốt hơn là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là ngô (bắp). Tốt hơn là phương pháp làm tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là đậu tương.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc nhiều hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc diệt khuẩn, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất dẫn dụ côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus hoặc nấm để tạo thành thuốc trừ sâu

những thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm bao gồm lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn hoặc chất pha loãng lỏng và lượng hữu hiệu của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác có thể được điều chế cùng với chế phẩm theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức 1, để tạo thành hỗn hợp sơ chế, hoặc các hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ chế phẩm theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức 1, và hai chế phẩm được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Ví dụ về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể điều chế với hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, axephat, acequinocyl, axetamiprit, acrinathrin, afidopyropen ($[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(\text{cyclopropylcarbonyl})\text{oxy}]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b\text{-}\delta\text{-cahydro-6,12-dihydroxy-4,6a,12b-trimethyl-11-oxo-9-(3-pyridinyl)-2H,11H-naphtho[2,1-}b\text{]pyrano[3,4-}e\text{]pyran-4-yl)methyl cyclopropanecarboxylat})$, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadiractin, azinphosmethyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borat, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, clorfenapyr, clorfluazuron, clocyprifos, clocyprifos-methyl, cromfenozit, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole (3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), cyclaniliprole (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-clo-6-[[1-(cyclopropylethyl)amino]carbonyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xycloprothrin, xycloxaprid ($((5S,8R)-1-[(6\text{-clo-3-pyridinyl)methyl}]-2,3,5,6,7,8\text{-hexahydro-9-nitro-5,8-Epoxy-1H-imidazo[1,2-}a\text{]azepine})$), cyflumetofen, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimetoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin,

endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenbutatiN-oxit,
 fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerat, fipronil,
 flometoquin (2-etyl-3,7-đimetyl-6-[4-(triflometoxy)phenoxy]-4-quinoliny methyl
 cacbonat), flonicamit, flubendiamit, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron,
 flufenoxystrobin (metyl (αE)-2-[[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]metyl]- α -
 (metoxymetylen)benzenaxetat), flufensulfon (5-clo-2-[(3,4,4-triflo-3-buten-1-
 yl)sulfonyl]thiazol), fluhexafon, fluopyram, flupiprole (1-[2,6-điclo-4-
 (triflometyl)phenyl]-5-[(2-metyl-2-propen-1-yl)amino]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-
 1*H*-pyrazol-3-carbonitril), flupyradifurone (4-[[6-clo-3-pyridinyl)metyl](2,2-
 đifloetyl)amino]-2(5*H*)-furanon), fluvalinat, tau-fluvalinat, fonophos, formetanat,
 fosthiazate, halofenozit, heptafluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-
 (metoxymetyl)phenyl)metyl 2,2-đimetyl-3-[(1*Z*)-3,3,3-triflo-1-propen-1-
 yl]xyclopropanecarboxylat), hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon,
 imidacloprit, indoxacarb, xà phòng trừ sâu, isofenphos, lufenuron, malathion,
 meperfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl)metyl (1*R*,3*S*)-3-(2,2-
 đicloethenyl)-2,2-đimetyl xyclopropanecarboxylat), metaflumizone, metaflumizone,
 methamidophos, metidation, methiodicarb, metomyl, metoprene, metoxyclo,
 metofluthrin, metoxyfenozit, metofluthrin, monocrotopho, monoflothrín ([2,3,5,6-
 tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl)metyl 3-(2-xyano-1-propen-1-yl)-2,2-
 đimetyl xyclopropanecarboxylat), nicotin, nitenpyram, nithiazin, novaluron,
 noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorat, phosriêng
 biêt, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite,
 protrifenbute, pyflubumide (1,3,5-trimetyl-*N*-(2-metyl-1-oxopropyl)-*N*-[3-(2-
 metylpropyl)-4-[2,2,2-triflo-1-metoxyl-1-(triflometyl)etyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-4-
 carboxamit), pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl,
 pyrifluquinazon, pyriminostrobin (metyl (αE)-2-[[[2-[(2,4-điclophenyl)amino]-6-
 (triflometyl)-4-pyrimidinyl]oxy]metyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat),
 pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodín, silafluofen, spinetoram, spinosad,
 spirođiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflo (*N*-
 [metyloxido[1-[6-(triflometyl)-3-pyridinyl]etyl]- λ^4 -sulfanylidén]cyanamit),
 tebufenozit, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos,

tetramethrin, tetrametylfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2,3,3-tetrametylxcyclopropancooxylat), tetraniliprole, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tioxazafen (3-phenyl-5-(2-thienyl)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumezopyrim (muối nội 2,4-đioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidin), triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, vi khuẩn có khả năng gây bệnh, virus có khả năng gây bệnh và nấm có khả năng gây bệnh.

Tốt hơn là thuốc trừ sâu như abamectin, axetamiprit, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadiractin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, clorfenapyr, clopyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamit, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinat, formetanat, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, metomyl, metoprene, metoxyfenozit, metofluthrin, monoflothrin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodin, spinetoram, spinosad, spiroticlofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumezopyrim, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, tất cả các chủng *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng virus nhiều mặt nhân.

Một phương án về chất sinh học để trộn với chế phẩm theo sáng chế bao gồm vi khuẩn gây chết cho côn trùng như *Bacillus thuringiensis* và nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* như thuốc trừ sâu sinh học MVP[®]

và MVPII[®] được điều chế bằng cách quy trình CellCap[®] (CellCap[®], MVP[®] và MVPII[®] là nhãn hiệu hàng hoá của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); nấm gây chết cho côn trùng như nấm nhọ xạ xanh; và virus gây chết cho côn trùng (cả hai trong tự nhiên và biến đổi gen) như virus hình que, virus nhiều mặt nhân (nucleopolyhedro viruses - NPV) như HzNPV (virus nhiều mặt nhõn *Helicoverpa zea*), AfNPV (virus nhiều mặt nhõn *Anagrapha falcifera*); và virus dạng hạt (granulosis virus-GV) như virus dạng hạt *Cydia pomonella* (CpGV).

Tốt hơn là chế phẩm, trong đó hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác với hợp chất có công thức 1. Trong một số trường hợp, tổ hợp với ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ được ưu tiên đặc biệt. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng thuộc nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác nhau. Hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE) như carbamat metomyl, oxamyl, thiodicarb, triazamat, và phosphat hữu cơ clopyrifos; chất đối kháng kênh clorua cổng GABA như xyclođien dieldrin và endosulfan, và phenylpyrazol ethiprol và fipronil; chất điều biến kênh natri như pyrethroid bifenthrin, xyfluthrin, *beta*-xyfluthrin, xyhalothrin, *lambda*-xyhalothrin, xypermethrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerat, metofluthrin và profluthrin; chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR) như neonicotinoit axetamiprit, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazin, thiacloprid, và thiametoxam, và sulfoxaflor; chất hoạt hóa allosteric thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR) như spinosyns spinetoram và spinosad; chất hoạt hóa kênh clorua như avermectin abamectin và emamectin; chất đẳng hiệu hormon vị thành niên như điofenolan, metoprene, fenoxycarb và pyriproxyfen; chất phong bế ăn homopteran chọn lọc như pymetrozine và flonicamid; chất ức chế phát triển ve bét như etoxazol; chất ức chế màng ngoài cùng của ty thể ATP syntaza như propargite; uncoupler của phosphoryl hoá oxy hóa nhờ phá vỡ gradien proton như clorfenapyr; chất phong

bể kênh thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR) như các chất tương tự cartap nereistoxin; chất ức chế sinh tổng hợp chitin như benzoyleure flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron, và buprofezin; dipteran moulting chất phá vỡ như xyromazin; chất chủ vận thụ thể ecdyson như điaxylhydrazin metoxyfenozit và tebufenozit; chất chủ vận thụ thể octopamin như amitraz; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp III màng ngoài cùng của ty thể như hydrametylnon; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp I màng ngoài cùng của ty thể như pyridaben; chất phong bế kênh canxi phụ thuộc điện thế như indoxacarb; chất ức chế axetyl CoA carboxylaza như spirodiclofen của axit tetric và tetramic, spiromesifen và spirotetramat; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II màng ngoài cùng của ty thể như β -ketonitril cyenopyrafen và cyflumetofen; chất điều biến thụ thể ryanidin như antranilic điamit chlorantraniliprole, cyantraniliprole và cyantraniliprole, điamit như flubendiamit, và phối tử thụ thể ryanodin như ryanodin; hợp chất, trong đó vị trí đích đáp ứng hoạt tính sinh học là chưa biết hoặc chưa được xác định đặc điểm như azadiractin, bifenazate, pyridalyl, pyrifluquinazon và triflumezopyrim; chất phá vỡ vi khuẩn màng dạ dày của côn trùng như *Bacillus thuringensis* và nội độc tố delta chúng tạo ra và *Bacillus sphaericus*; và các chất sinh học bao gồm virus nhiều mặt nhân (NPV) và các virus trừ sâu tự nhiên hoặc biến đổi gen khác.

Ví dụ khác về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể điều chế được với chế phẩm theo sáng chế là: thuốc diệt nấm như acibenzolar-S-metyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl (bao gồm benalaxyl-M), benodanil, benomyl, benthiavalicarb (bao gồm benthiavalicarb-isopropyl), benzovindiflupyr, betoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, boscalid, bromuconazol, bupirimate, buthiobate, carboxin, carpropamit, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, chlozolate, đồng hydroxit, đồng oxyclorea, đồng sulfat, coumoxystrobin, cyazofamid, cyflufenamid, xymoxanil, cyproconazol, xyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumentorim, dimethirimol, dimetomorph, dimoxystrobin, diniconazol (bao gồm diniconazol-M), dinocap, dithianon, dithiolanes, dodemorph, dodin, econazol,

etaconazol, edifenphos, enoxastrobin (còn gọi là enestroburin), epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, etridiazol, famoxadone, fenamidone, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferimzone, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxystrobin, flumorph, fluopicolide, fluopyram, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamit, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fthalogenua (còn gọi là phtalogenua), fuberidazol, furalaxyl, furametpyr, hexaconazol, hymexazol, guazatine, imazalil, imibenconazol, iminoctadine albesilate, iminoctadine triaxetat, iodicarb, ipconazol, isofetamid, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, mandestrobin, maneb, mapanipyrin, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl (bao gồm metalaxyl-M/mefenoxam), metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenone, myclobutanil, naftitine, neo-asozin (ferric metanarsonate), nuarimol, octhilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, oxathiapiprolin, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, oxytetracycline, penconazol, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, perfurazoate, phospho axit (bao gồm muối của chúng, ví dụ, fosetyl-aluminm), picarbutrattox, picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazol, prochloraz, procymidone, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazol, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributacarb, pyrifenox, pyrioifenone, perisoxazol, pyrimethanil, pyrifenox, pyrolnitrin, pyroquilon, quinconazol, quinmethionate, quinoxifen, quintozone, silthiofam, sedaxane, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, lru huỳnh, tebuconazol, tebufloquin, teclofthalam, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamit, thiophanat, thiophanat-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolprocarb, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, triaxit đồng sulfat, triclopyricarb, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizole, trimoprhamit tricyclazol, triforine, triticonazol, uniconazol, validamycin, valifenalate (còn gọi là valifenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamit và 1-[4-[4-[5-(2,6-điflophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-

1*H*-pyrazol-1-yl]etanon; thuốc diệt giun tròn như fluopyram, spirotetramat, thiodicarb, fosthiazate, abamectin, iprodion, fluensulfon, dimetyl disulfua, tioxazafen, 1,3-điclopropen (1,3-D), metam (natri và kali), dazomet, clopicrin, fenamiphos, etoprophos, cadusaphos, terbufos, imicyafos, oxamyl, carbofuran, tioxazafen, *Bacillus firmus* và *Pasteuria nishizawae*; chất kháng khuẩn như streptomycin; thuốc ghẻ như amitraz, chinomethionat, clobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazol, fenazaquin, fenbutatiN-oxit, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben và tebufenpyrad.

Trong một số trường hợp, hỗn hợp chứa hợp chất theo sáng chế với các hợp chất hoặc chất (tức là hoạt chất) có hoạt tính sinh học (đặc biệt là phòng trừ loài gây hại không xương sống) có thể tạo ra hiệu quả lớn hơn cộng hợp (tức là hiệp đồng). Luôn mong muốn giảm bớt lượng chất hoá học được giải phóng ra môi trường trong khi vẫn đảm bảo việc phòng trừ động vật gây hại hữu hiệu. Khi tác dụng hiệp đồng của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được phát hiện ở tỷ lệ dùng mang lại mức phòng trừ động vật gây hại thoả đáng trong lĩnh vực nông nghiệp, các hỗn hợp này có thể làm giảm chi phí thu hoạch và ô nhiễm môi trường.

Hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm chứa nó có thể được phun cho cây chuyển gen để biểu hiện sự gây độc protein cho loài gây hại không xương sống (như nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*). Việc sử dụng này có thể tạo ra phổ bảo vệ cây rộng hơn và có lợi về tính kháng. Tác dụng của việc áp dụng ngoại sinh hợp chất phòng trừ loài gây hại không xương sống theo sáng chế có thể hiệp đồng với protein gây độc được biểu hiện.

Các tài liệu tham khảo chung về chất bảo vệ trong nông nghiệp này (tức là các thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ và tác nhân sinh học) gồm *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Hợp chất theo sáng chế có thể được kết hợp hoặc được điều chế cùng polynucleotit bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, ADN, ARN, và/hoặc

nucleotit được cải biến bằng hóa chất tác động đến lượng đích cụ thể nhờ quá trình điều hòa ngược, can thiệp, ức chế, hoặc làm câm bản sao có nguồn gốc từ gen mang lại tác dụng trừ sâu.

Đối với các phương án, trong đó một hoặc nhiều thành phần phối trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ khối lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) với hợp chất có công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Tốt hơn là tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm một cách đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Điều hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ loài gây hại không xương sống vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất có công thức 1.

Bảng A nêu các tổ hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác để minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế. Cột đầu tiên của Bảng A thể hiện chất phòng trừ loài gây hại không xương sống cụ thể (ví dụ, "Abamectin" ở dòng đầu tiên). Cột thứ hai của Bảng A thể hiện kiểu tác động (nếu đã biết) của chất phòng trừ loài gây hại không xương sống. Cột thứ ba của Bảng A thể hiện phương án/ các phương án về các khoảng tỷ lệ khối lượng mà chất phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể được dùng so với hợp chất có công thức 1, (ví dụ, "50:1 đến 1:50" abamectin so với hợp chất có công thức 1 theo khối lượng). Do đó, ví dụ, dòng đầu tiên của Bảng A thể hiện cụ thể tổ hợp của hợp chất có công thức 1 với abamectin có thể được dùng nằm trong khoảng tỷ lệ khối lượng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của Bảng A được cấu trúc tương tự. Bảng A còn thể hiện các hỗn hợp cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác minh họa cho hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp sáng chế và gồm các phương án bổ sung có khoảng tỷ lệ khối lượng với tỷ lệ dùng, một số hỗn hợp cụ thể có hiệu quả hiệp đồng đáng kể.

Bảng A

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Abamectin	chất hoạt hóa kênh clorua	50:1 đến 1:50
Axetamiprit	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	150:1 đến 1:200
Amitraz	chất chủ vận thụ thể octopamin	200:1 đến 1:100
Avermectin	lacton vòng lớn	50:1 đến 1:50
Azadiractin	vị trí tác động chưa biết	100:1 đến 1:120
Beta-xyfluthrin	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Bifenthrin	chất điều biến kênh canxi	100:1 đến 1:10
Buprofezin	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	500:1 đến 1:50
Cartap	chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	100:1 đến 1:200
Chlorantraniliprole	chất điều biến thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Clorfenapyr	chất cách ly oxy hóa phosphoryl hoá	300:1 đến 1:200
Clopyrifos	chất ức chế axetylcholinesteraza	500:1 đến 1:200
Clothianidin	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	100:1 đến 1:400
Cyantraniliprole	chất điều biến thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Xyfluthrin	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Xyhalothrin	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Xypermethrin	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Xyromazin	chất phá vỡ quá trình thay lông của côn trùng hai cánh	400:1 đến 1:50
Δeltamethrin	chất điều biến kênh canxi	50:1 đến 1:400
Dieldrin	chất đối kháng kênh clorua cổng GABA	200:1 đến 1:100
Dinotefuran	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	150:1 đến 1:200
Điofenolan	chất đẳng hiệu hormon vị thành niên	150:1 đến 1:200
Emamectin	chất hoạt hóa kênh clorua	50:1 đến 1:10
Endosulfan	chất đối kháng kênh clorua cổng GABA	200:1 đến 1:100

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Esfenvalerat	chất điều biến kênh canxi	100:1 đến 1:400
Ethiprol	chất đối kháng kênh clorua điều hòa GABA	200:1 đến 1:100
Fenothiocarb		150:1 đến 1:200
Fenoxycarb	chất đẳng hiệu hormon vị thành niên	500:1 đến 1:100
Fenvalerat	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Fipronil	chất đối kháng kênh clorua điều hòa GABA	150:1 đến 1:100
Flonicamit	chất ức chế ăn chọn lọc ở côn trùng cánh giồng	200:1 đến 1:100
Flubendiamit	ryanodine chất điều biến thụ thể	100:1 đến 1:120
Flufenoxuron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
Hexaflumuron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	300:1 đến 1:50
Hydrametylnon	chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất III màng ngoài cùng của ty thể	150:1 đến 1:250
Imidacloprit	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	1000:1 đến 1:1000
Indoxacarb	chất phong bế kênh canxi phụ thuộc điện thế	200:1 đến 1:50
Lambda-xyhalothrin	chất điều biến kênh canxi	50:1 đến 1:250
Lufenuron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	500:1 đến 1:250
Metaflumizone	chất phong bế kênh canxi phụ thuộc điện thế	200:1 đến 1:200
Metomyl	chất ức chế axetylcholinesteraza	500:1 đến 1:100
Metoprene	chất đẳng hiệu hormon vị thành niên	500:1 đến 1:100
Metoxyfenozit	chất chủ vận thụ thể ecdyson	50:1 đến 1:50
Nitenpyram	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	150:1 đến 1:200
Nithiazin	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	150:1 đến 1:200

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
Novaluron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	500:1 đến 1:150
Oxamyl	chất ức chế axetylcholinesterasas	200:1 đến 1:200
Pymetrozine	chất ức chế ăn chọn lọc ở côn trùng cánh giồng	200:1 đến 1:100
Pyrethrin	chất điều biến kênh canxi	100:1 đến 1:10
Pyridaben	chất ức chế vận chuyển điện tử phức chất I màng ngoài cùng của ty thể	200:1 đến 1:100
Pyridalyl	vị trí tác động chưa biết	200:1 đến 1:100
Pyriproxyfen	chất đẳng hiệu hormon vị thành niên	500:1 đến 1:100
Ryanodin	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Spinetoram	chất hoạt hóa enzym dị lập thể thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	150:1 đến 1:100
Spinosad	chất hoạt hóa enzym dị lập thể thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	500:1 đến 1:10
Spirodiclofen	chất ức chế axetyl CoA carboxylaza	200:1 đến 1:200
Spiromesifen	chất ức chế axetyl CoA carboxylaza	200:1 đến 1:200
Tebufenozit	chất chủ vận thụ thể ecdyson	500:1 đến 1:250
Thiacloprid	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	100:1 đến 1:200
Thiametoxam	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR)	1250:1 đến 1:1000
Thiodicarb	chất ức chế axetylcholinesterasas	500:1 đến 1:400
Thiosultap-natri	Thụ thể axetylcholin nicotin (nAChR) chất phong bế kênh	150:1 đến 1:100
Tralomethrin	chất điều biến kênh canxi	150:1 đến 1:200
Triazamate	chất ức chế axetyl cholinsteraza	250:1 đến 1:100
Triflumezopyrim	thuốc trừ sâu mesoion	200:1 đến 1:100
Triflumuron	chất ức chế tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	chất sinh học	50:1 đến 1:10
Nội độc tố delta	chất sinh học	50:1 đến 1:10

Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Kiểu tác dụng hoặc Nhóm hoá chất	Tỷ lệ khối lượng thông thường
<i>Bacillus thuringiensis</i>		
NPV (ví dụ, Gemstar)	chất sinh học	50:1 đến 1:10

Tốt hơn là, chế phẩm theo sáng chế, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất phòng trừ loài gây hại không xương sống được nêu trong Bảng A trên.

Tỷ lệ khối lượng giữa hợp chất, kể cả hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung thường nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000, với một phương án nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, phương án khác nằm trong khoảng từ 250:1 đến 1:200 và phương án khác nữa nằm trong khoảng từ 100:1 và 1:50.

Bảng B1 đến B12 dưới đây đưa ra các phương án của chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (số hợp chất dùng để chỉ các hợp chất trong Bảng chỉ số A–C) và chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung.

Bảng B1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-1	26	và	Abamectin	B1-38	26	và	Indoxacarb
B1-2	26	và	Axetamiprit	B1-39	26	và	Lambda-xyhalothrin
B1-3	26	và	Amitraz	B1-40	26	và	Lufenuron
B1-4	26	và	Avermectin	B1-41	26	và	Metaflumizone
B1-5	26	và	Azađiractin	B1-42	26	và	Metomyl
B1-6	26	và	Bensultap	B1-43	26	và	Metoprene
B1-7	26	và	Beta-xyfluthrin	B1-44	26	và	Metoxyfenozit
B1-8	26	và	Bifenthrin	B1-45	26	và	Nitenpyram
B1-9	26	và	Buprofezin	B1-46	26	và	Nithiazin
B1-10	26	và	Cartap	B1-47	26	và	Novaluron
B1-11	26	và	Chlorantraniliprole	B1-48	26	và	Oxamyl
B1-12	26	và	Clorfenapyr	B1-49	26	và	Phosmet
B1-13	26	và	Clopyrifos	B1-50	26	và	Pymetrozine
B1-14	26	và	Clothianidin	B1-51	26	và	Pyrethrin

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và	Chất phòng trừ loài gây hại không xương sống
B1-15	26	và	Cyantraniliprole	B1-52	26	và	Pyridaben
B1-16	26	và	Xyfluthrin	B1-53	26	và	Pyridalyl
B1-17	26	và	Xyhalothrin	B1-54	26	và	Pyriproxyfen
B1-18	26	và	Xypermethrin	B1-55	26	và	Ryanodín
B1-19	26	và	Xyromazin	B1-56	26	và	Spinetoram
B1-20	26	và	Deltamethrin	B1-57	26	và	Spinosad
B1-21	26	và	Dieldrin	B1-58	26	và	Spirodiclofen
B1-22	26	và	Dinotefuran	B1-59	26	và	Spiromesifen
B1-23	26	và	Điofenolan	B1-60	26	và	Spirotetramat
B1-24	26	và	Emamectin	B1-61	26	và	Sulfoxaflor
B1-25	26	và	Endosulfan	B1-62	26	và	Tebufenozit
B1-26	26	và	Esfenvalerat	B1-63	26	và	Tefluthrin
B1-27	26	và	Ethiprol	B1-64	26	và	Thiacloprid
B1-28	26	và	Fenothiocarb	B1-65	26	và	Thiametoxam
B1-29	26	và	Fenoxycarb	B1-66	26	và	Thiodicarb
B1-30	26	và	Fenvalerat	B1-67	26	và	Thiosultap-natri
B1-31	26	và	Fipronil	B1-68	26	và	Tolfenpyrad
B1-32	26	và	Flonicamit	B1-69	26	và	Tralomethrin
B1-33	26	và	Flubendiamit	B1-70	26	và	Triazamate
B1-34	26	và	Flufenoxuron	B1-71	26	và	Triflumezopyrim
B1-35	26	và	Hexaflumuron	B1-72	26	và	Triflumuron
B1-36	26	và	Hydrametylnon	B1-73	26	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-37	26	và	Imidacloprit	B1-74	26	và	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
				B1-75	26	và	NPV (ví dụ, Gemstar)

Bảng B2

Bảng B2 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 23. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B2 được gọi là B2-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 23 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B3

Bảng B3 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 25. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B3

được gọi là B3-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 25 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B4

Bảng B4 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 38. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B4 được gọi là B4-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 38 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B5

Bảng B5 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 39. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B5 được gọi là B5-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 39 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B6

Bảng B6 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 40. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B6 được gọi là B6-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 40 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B7

Bảng B7 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 43. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B7 được gọi là B7-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 43 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B8

Bảng B8 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 46. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B8 được gọi là B8-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 46 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B9

Bảng B9 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 48. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B9

được gọi là B9-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 48 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B10

Bảng B10 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B10 được gọi là B10-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 54 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B11

Bảng B11 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 65. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B11 được gọi là B11-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 65 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B12

Bảng B12 giống với Bảng B1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 66. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B12 được gọi là B12-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 66 chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung abamectin.

Hỗn hợp cụ thể được nêu trong các Bảng từ B1 đến B77 thường kết hợp hợp chất có công thức 1 với chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác với tỷ lệ được nêu cụ thể trong Bảng A.

Các Bảng từ C1 đến C12 dưới đây là các phương án về chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (Hợp chất số để chỉ các hợp chất trong các Bảng phụ lục A-C) và một chất diệt nấm bổ sung. Các Bảng C1-C12 liệt kê tiếp tỷ lệ khối lượng cụ thể thông thường của các hỗn hợp của các Bảng từ C1 đến C12. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C1 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 1 của Bảng chỉ số A với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C1

<u>Bảng B2</u>	<u>Bảng B2</u>	<u>Bảng B2</u>	<u>Bảng B2</u>	<u>Bảng B2</u>								
C1-1	26	và	Abamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-2	26	và	Axetamiprit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-3	26	và	Amitraz	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-4	26	và	Avermectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-5	26	và	Azadiractin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-6	26	và	Bensultap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-7	26	và	Beta-xyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-8	26	và	Bifenthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-9	26	và	Buprofezin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-10	26	và	Cartap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-11	26	và	Chlorantraniliprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-12	26	và	Clorfenapyr	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-13	26	và	Clopyrifos	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-14	26	và	Clothianidin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-15	26	và	Cyantraniliprole	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-16	26	và	Xyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-17	26	và	Xyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-18	26	và	Xypermethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-19	26	và	Xyromazin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-20	26	và	Deltamethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	26	và	Dieldrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	26	và	Dinotefuran	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	26	và	Diofenolan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	26	và	Emamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	26	và	Endosulfan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	26	và	Esfenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	26	và	Ethiprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	26	và	Fenothiocarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	26	và	Fenoxycarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	26	và	Fenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	26	và	Fipronil	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	26	và	Flonicamit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	26	và	Flubendiamit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	26	và	Flufenoxuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	26	và	Hexaflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	26	và	Hydrametylnon	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	26	và	Imidacloprit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	26	và	Indoxacarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	26	và	Lambda-xyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-40	26	và	Lufenuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	26	và	Metaflumizone	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	26	và	Metomyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	26	và	Metoprene	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	26	và	Metoxyfenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	26	và	Nitenpyram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	26	và	Nithiazin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	26	và	Novaluron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	26	và	Oxamyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	26	và	Phosmet	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	26	và	Pymetrozine	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	26	và	Pyrethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	26	và	Pyridaben	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	26	và	Pyridalyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	26	và	Pyriproxyfen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	26	và	Ryanodín	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	26	và	Spinetoram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	26	và	Spinosad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	26	và	Spirodiclofen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	26	và	Spiromesifen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	26	và	Spirotetramat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	26	và	Sulfoxafloor	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	26	và	Tebufenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	26	và	Tefluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	26	và	Thiacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	26	và	Thiametoxam	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	26	và	Thiodicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	26	và	Thiosultap-natri	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	26	và	Tolfenpyrad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	26	và	Tralomethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	26	và	Triazamate	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	26	và	Triflumezopyrim	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	26	và	Triflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	26	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	26	và	Nội độc tố delta <i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-75	26	và	NPV (ví dụ, Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
-------	----	----	-------------------------	-------	------	-----	-----	-----	-----	-----	------	-------

Bảng C2

Bảng C2 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 23. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C2 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 23 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C3

Bảng C3 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 25. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C3 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 25 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C4

Bảng C4 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 38. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C4 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 38 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C5

Bảng C5 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 39. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C5 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 39 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C6

Bảng C6 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 40. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C6 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 40 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C7

Bảng C7 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 43. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất

của dòng thứ nhất của Bảng C7 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 43 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C8

Bảng C8 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 46. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C8 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 46 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C9

Bảng C9 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 48. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C9 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 48 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C10

Bảng C10 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 54. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C10 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 54 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C11

Bảng C11 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 65. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C11 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 65 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Bảng C12

Bảng C12 giống với Bảng C1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 66. Ví dụ, mục tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C12 nêu cụ thể hỗn hợp của hợp chất 66 với abamectin được phun với tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 1 và 1 phần abamectin.

Các Bảng D1 đến D12 dưới đây là các phương án là các phương án của chế phẩm cụ thể chứa hợp chất có công thức 1 (số hợp chất (Cmpd. No.) dùng để chỉ các hợp chất trong Bảng phụ lục A-C) và thuốc diệt nấm bổ sung.

Bảng D1

Hỗn hợp số	Hợp chất số	và Thuốc diệt nấm	Hỗn hợp số	Hợp chất số	và Thuốc diệt nấm
D1-1	26	và Probenazol	D1-17	26	và Difenconazol
D1-2	26	và Tiadinil	D1-18	26	và Cyproconazol
D1-3	26	và Isotianil	D1-19	26	và Propiconazol
D1-4	26	và Pyroquilon	D1-20	26	và Fenoxanil
D1-5	26	và Metominostrobin	D1-21	26	và Ferimzone
D1-6	26	và Flutolanil	D1-22	26	và Fthalogenua
D1-7	26	và Validamycin	D1-23	26	và Kasugamycin
D1-8	26	và Furametpyr	D1-24	26	và Picoxystrobin
D1-9	26	và Pencycuron	D1-25	26	và Penthiopyrad
D1-10	26	và Simeconazol	D1-26	26	và Famoxadone
D1-11	26	và Orysastrobin	D1-27	26	và Xymoxanil
D1-12	26	và Trifloxystrobin	D1-28	26	và Proquinazid
D1-13	26	và Isoprothiolane	D1-29	26	và Flusilazol
D1-14	26	và Azoxystrobin	D1-30	26	và Mancozeb
D1-15	26	và Tricyclazol	D1-31	26	và Đồng hydroxit
D1-16	26	và Hexaconazol	D1-32	26	và (a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-điflophenyl)-4,5-đihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1*H*-pyrazol-1-yl]etanon

Bảng D2

Bảng D2 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 23. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D2 được gọi là D2-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 23 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D3

Bảng D3 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 25. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D3

được gọi là D3-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 25 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D4

Bảng D4 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 38. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D4 được gọi là D4-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 38 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D5

Bảng D5 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 39. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D5 được gọi là D5-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 39 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D6

Bảng D6 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 40. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D6 được gọi là D6-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 40 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D7

Bảng D7 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 43. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D7 được gọi là D7-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 43 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D8

Bảng D8 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 46. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D8 được gọi là D8-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 46 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D9

Bảng D9 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 48. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D9

được gọi là D9-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 48 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D10

Bảng D2 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D10 được gọi là D10-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 54 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D11

Bảng D11 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 65. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D11 được gọi là D11-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 65 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D12

Bảng D12 giống với Bảng D1, chỉ khác là hợp chất 26 trong cột có tiêu đề “Hợp chất số” được thay bằng hợp chất 66. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D12 được gọi là D12-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 66 và thuốc diệt nấm bổ sung probenazol.

Các loài gây hại không xương sống được phòng trừ trong các lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp bằng cách đưa một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, thường dưới dạng chế phẩm, với lượng hữu hiệu sinh học, vào môi trường của các loài gây hại, bao gồm các khu vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp bị phá hại, khu vực cần được bảo vệ, hoặc đưa trực tiếp lên các loài gây hại cần được phòng trừ.

Vì vậy, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp, bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, hoặc với chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất và lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Ví dụ về chế phẩm thích hợp chứa hợp chất theo sáng chế và lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung bao gồm chế phẩm

dạng hạt, trong đó hoạt chất bổ sung có mặt trong cùng hạt chứa hợp chất theo sáng chế hoặc trong hạt riêng biệt với hợp chất theo sáng chế.

Để đạt được việc tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi loài gây hại không xương sống, chế phẩm thường được phun cho hạt của cây trước khi trồng, cho lá (ví dụ, lá, thân, hoa, quả) của cây trồng hoặc cho đất hoặc môi trường phát triển khác trước khi hoặc sau khi cây được trồng.

Theo một phương án, phương pháp tiếp xúc là bằng cách phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng hạt chứa hợp chất theo sáng chế có thể được phun lên tán lá hoặc vào đất. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được chuyển vận một cách hiệu quả qua sự hấp thụ của cây bằng cách cho cây tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế được phun vào đất ở dạng chế phẩm lỏng thấm vào đất, chế phẩm dạng hạt, xử lý vườn ươm hoặc ngâm mảnh cây ghép. Tốt hơn là, chế phẩm theo sáng chế ở dạng chế phẩm lỏng thấm vào đất. Tốt hơn nữa là, phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống, bao gồm bước cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường xung quanh nó tiếp xúc với hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế với lượng hữu hiệu sinh học. Tốt hơn nữa, nếu phương pháp, trong đó môi trường là đất và hỗn hợp được đưa vào đất dưới dạng chế phẩm lỏng thấm vào đất. Tốt hơn nữa là, hợp chất theo sáng chế cũng hiệu quả bằng cách phun khu trú vào vị trí bị phá hại. Các phương pháp tiếp xúc khác bao gồm phun hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trực tiếp và phun tồn lưu, phun khí, gel, phủ hạt, tạo vi nang, hấp thu có hệ thống, môi, vòng đeo tai, viên thức ăn, dạng sương mù, thuốc hun, dạng sol khí, dạng bụi và một số dạng khác. Một phương án về phương pháp tiếp xúc là dạng hạt phân bón ổn định về kích thước, dạng thoi hoặc dạng viên nén chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được kết hợp vào vật liệu để tạo thành dụng cụ phòng trừ động vật không xương sống (ví dụ, lưới bẫy côn trùng).

Hợp chất theo sáng chế có thể được dùng để xử lý toàn bộ cây, các bộ phận của thực vật và các hạt giống. Cây giống và hạt giống và cây trồng có thể thu được bằng các phương pháp nhân giống và gây giống thông thường hoặc bằng các phương pháp xử lý bằng kỹ thuật di truyền. Cây trồng hoặc hạt giống được biến

đổi gen (cây trồng hoặc hạt giống chuyển gen) là cây trồng và hạt giống có gen khác loài (gen chuyển) đã được kết hợp một cách ổn định vào genom của thực vật hoặc hạt. Gen chuyển mà được xác định bởi vị trí cụ thể của nó trong genom thực vật được gọi là thể biến nạp hoặc thể chuyển gen.

Cây trồng và cây trồng từ hạt biến đổi gen có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm các cây trồng có tính chống chịu một hoặc nhiều sức ép sinh học (loài gây hại như giun tròn, côn trùng, ve bét, nấm, v.v.) hoặc sức không sinh học (sự khô hạn, nhiệt độ lạnh, độ mặn của đất, v.v.), hoặc có các đặc tính mong muốn khác. Cây trồng và hạt giống có thể được biến đổi gen để có các tính trạng, ví dụ, khả năng dung nạp thuốc diệt cỏ, tính chống chịu sâu bọ, protein dầu cải biến hoặc khả năng dung nạp khô hạn. Cây trồng và hạt giống biến đổi gen hữu ích chứa một thể biến nạp gen hoặc tổ hợp của các thể biến nạp gen được liệt kê trong Bảng Z. Thông tin bổ sung về các biến đổi gen được liệt kê trong Bảng Z có thể thu được từ các dữ liệu sau:

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

<http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

Các từ viết tắt sau được sử dụng trong Bảng Z là như sau: tol. là khả năng dung nạp, res. tính chống chịu, SU là sulfonylure, ALS là acetolactat syntaza, HPPD là 4-hydroxyphenylpyruvat dioxyaza, NA là không có sẵn.

Bảng Z

Cây trồng	Tên thể chuyển gen	Mã thể chuyển gen	Chủng	Gen
Cỏ linh lăng	J101	MON-00101-8	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cỏ linh lăng	J163	MON-00163-7	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây hạt cải dầu*	23-18-17 (Thể 18)	CGN-89465-2	Dầu của axit lauric cao	te
Cây hạt cải dầu*	23-198 (Thể 23)	CGN-89465-2	Dầu của axit lauric cao	te
Cây hạt cải dầu*	61061	DP-061061-7	Dung nạp glyphosat	gat4621
Cây hạt cải dầu*	73496	DP-073496-4	Dung nạp glyphosat	gat4621
Cây hạt cải dầu*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây hạt cải dầu*	GT73 (RT73)	MON-00073-7	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây hạt cải dầu*	HCN10 (Topas)	NA	Dung nạp glufosinat	bar

	19/2)			
Cây hạt cải dầu*	HCN28 (T45)	ACS-BN008-2	Dung nạp glufosinat	pat (syn)
Cây hạt cải dầu*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BN007-1	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	MON88302	MON-88302-9	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây hạt cải dầu*	MPS961	NA	Phá vỡ phytat	phyA
Cây hạt cải dầu*	MPS962	NA	Phá vỡ phytat	phyA
Cây hạt cải dầu*	MPS963	NA	Phá vỡ phytat	phyA
Cây hạt cải dầu*	MPS964	NA	Phá vỡ phytat	phyA
Cây hạt cải dầu*	MPS965	NA	Phá vỡ phytat	phyA
Cây hạt cải dầu*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	MS8	ACS-BN005-8	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	OXY-235	ACS-BN011-5	Chống chịu Oxynil	bxn
Cây hạt cải dầu*	PHY14	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	PHY23	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	PHY35	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	PHY36	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	Dung nạp glufosinat	bar
Cây hạt cải dầu*	RF3	ACS-BN003-6	Dung nạp glufosinat	bar
Cây đậu	EMBRAPA 5,1	EMB-PV051-1	Chống chịu bệnh	ac1 (có nghĩa và đối nghĩa)
Cà tím (Cây cà tím)	EE-1		Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây cẩm chướng	11 (7442)	FLO-07442-4	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	11363 (1363A)	FLO-11363-1	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	1226A (11226)	FLO-11226-8	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	123.8.12	FLO-40689-6	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	1351A (11351)	FLO-11351-7	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	1400A (11400)	FLO-11400-2	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	15	FLO-00015-2	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	16	FLO-00016-3	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	4	FLO-00004-9	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)

Cây cẩm chướng	66	FLO-00066-8	SU tol.; làm làm chậm quá trình già cỗi	surB; acc
Cây cẩm chướng	959A (11959)	FLO-11959-3	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	988A (11988)	FLO-11988-7	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	26407	IFD-26497-2	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cây cẩm chướng	25958	IFD-25958-3	SU tol.; màu sắc hoa biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Rau diếp xoăn	RM3-3	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-4	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-6	NA	Dung nạp glufosinat	bar
Cây bông	19-51a	DD-01951A-7	Dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	S4-HrA
Cây bông	281-24-236	DAS-24236-5	Dung nạp glufosinat; chống chịu sâu bọ	pat (syn); cry1F
Cây bông	3006-210-23	DAS-21023-5	Dung nạp glufosinat; chống chịu sâu bọ	pat (syn); cry1Ac
Cây bông	31707	NA	Chống chịu Oxylin; chống chịu sâu bọ	bxn; cry1Ac
Cây bông	31803	NA	Chống chịu Oxylin; chống chịu sâu bọ	bxn; cry1Ac
Cây bông	31807	NA	Chống chịu Oxylin; chống chịu sâu bọ	bxn; cry1Ac
Cây bông	31808	NA	Chống chịu Oxylin; chống chịu sâu bọ	bxn; cry1Ac
Cây bông	42317	NA	Chống chịu Oxylin; chống chịu sâu bọ	bxn; cry1Ac
Cây bông	BNLA-601	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây bông	BXN10211	BXN10211-9	Chống chịu Oxylin	bxn; cry1Ac
Cây bông	BXN10215	BXN10215-4	Chống chịu Oxylin	bxn; cry1Ac
Cây bông	BXN10222	BXN10222-2	Chống chịu Oxylin	bxn; cry1Ac
Cây bông	BXN10224	BXN10224-4	Chống chịu Oxylin	bxn; cry1Ac
Cây bông	COT102	SYN-IR102-7	Chống chịu sâu bọ	vip3A(a)
Cây bông	COT67B	SYN-IR67B-1	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	COT202		Chống chịu sâu bọ	vip3A
Cây bông	Thẻ 1	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây bông	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab-Ac
Cây bông	GHB119	BCS-GH005-8	Chống chịu sâu bọ	cry2Ae
Cây bông	GHB614	BCS-GH002-5	Dung nạp glyphosat	2mepsps
Cây bông	GK12	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab-Ac
Cây bông	LLCây bông25	ACS-GH001-3	Dung nạp glufosinat	bar
Cây bông	MLS 9124	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1C
Cây bông	MON1076	MON-89924-2	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây bông	MON1445	MON-01445-2	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây bông	MON15985	MON-15985-7	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac; cry2Ab2
Cây bông	MON1698	MON-89383-1	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

Cây bông	MON531	MON-00531-6	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây bông	MON757	MON-00757-7	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây bông	MON88913	MON-88913-8	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây bông	Nqwe Chi 6 Bt	NA	Chống chịu sâu bọ	NA?
Cây bông	SKG321	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1A; CpTI
Cây bông	T303-3	BCS-GH003-6	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Cây bông	T304-40	BCS-GH004-7	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Cây bông	CE43-67B		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	CE46-02A		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	CE44-69D		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	1143-14A		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	1143-51B		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	T342-142		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	PV-GHGT07 (1445)		Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây bông	EE-GH3		Dung nạp glyphosat	mepsps
Cây bông	EE-GH5		Chống chịu sâu bọ	cry1Ab
Cây bông	MON88701	MON-88701-3	Dung nạp dicamba & glufosinat	dmo; bar biến đổi
Cây bông	OsCr11		Chống dị ứng	Cry j biến đổi
Creeping Bentgrass	ASR368	SMG-36800- 2	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây khuynh diệp	20-C		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp	12-5C		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp	12-5B		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp	107-1		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp	1/9/2001		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp	2/1/2001		Dung nạp muối	codA
Cây khuynh diệp			Lạnh tol.	des9
Cây lanh	FP967	CDC-FL001-2	Dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	als
Cây đậu lăng	RH44		Chịu Imidazolinon	als
Cây ngô	3272	SYN-E3272-5	Được cải biến alpha- amylase	amy797E
Cây ngô	5307	SYN-05307-1	Chống chịu sâu bọ	ecry3,1Ab
Cây ngô	59122	DAS-59122-7	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry34Ab1; cry35Ab1; pat pat; dam
Cây ngô	676	PH-000676-7	Dung nạp glufosinat; kiểm soát quá trình thụ phần	
Cây ngô	678	PH-000678-9	Dung nạp glufosinat; kiểm soát quá trình thụ phần	pat; dam
Cây ngô	680	PH-000680-2	Dung nạp glufosinat; kiểm soát quá trình thụ phần	pat; dam
Cây ngô	98140	DP-098140-6	Dung nạp Glyphosat; Dung nạp thuốc diệt cỏ	gat4621; zm-hra

			ALS	
Cây ngô	Bt10	NA	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Ab; pat
Cây ngô	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Ab; bar
Cây ngô	BVLA430101	NA	Phá vỡ phytat	phyA2
Cây ngô	CBH-351	ACS-ZM004-3	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry9C; bar
Cây ngô	DAS40278-9	DAS40278-9	Dung nạp 2,4-D	aad-1
Cây ngô	DBT418	DKB-89614-9	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Ac; pinII; bar
Cây ngô	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	Dung nạp glufosinat	bar
Cây ngô	GA21	MON-00021-9	Dung nạp glyphosat	mepsps
Cây ngô	GG25		Dung nạp glyphosat	mepsps
Cây ngô	GJ11		Dung nạp glyphosat	mepsps
Cây ngô	FI117		Dung nạp glyphosat	mepsps
Cây ngô	GAT-ZM1		Dung nạp glufosinat	pat
Cây ngô	LY038	REN-00038-3	Lysin tăng	cordapA
Cây ngô	MIR162	SYN-IR162-4	Chống chịu sâu bọ	vip3Aa20
Cây ngô	MIR604	SYN-IR604-5	Chống chịu sâu bọ	mcry3A
Cây ngô	MON801 (MON80100)	MON801	Chống chịu sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây ngô	MON802	MON-80200-7	Chống chịu sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây ngô	MON809	PH-MON-809- 2	Chống chịu sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây ngô	MON810	MON-00810-6	Chống chịu sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây ngô	MON832	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây ngô	MON863	MON-00863-5	Chống chịu sâu bọ	cry3Bb1
Cây ngô	MON87427	MON-87427-7	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây ngô	MON87460	MON-87460-4	Chịu hạn	cspB
Cây ngô	MON88017	MON-88017-3	Chống chịu sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây ngô	MON89034	MON-89034-3	Chống chịu sâu bọ	cry2Ab2; cry1A.105
Cây ngô	MS3	ACS-ZM001-9	Dung nạp glufosinat; kiểm soát quá trình thụ phấn	bar; barnaza
Cây ngô	MS6	ACS-ZM005-4	Dung nạp glufosinat; kiểm soát quá trình thụ phấn	bar; barnaza
Cây ngô	NK603	MON-00603-6	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps

Cây ngô	T14	ACS-ZM002-1	Dung nạp glufosinat	(aroA:CP4) pat (syn)
Cây ngô	T25	ACS-ZM003-2	Dung nạp glufosinat	pat (syn)
Cây ngô	TC1507	DAS-01507-1	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1Fa2; pat
Cây ngô	TC6275	DAS-06275-8	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	mocry1F; bar
Cây ngô	VIP1034		Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	vip3A; pat
Cây ngô	43A47	DP-043A47-3	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Cây ngô	40416	DP-040416-8	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Cây ngô	32316	DP-032316-8	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Cây ngô	4114	DP-004114-3	Chống chịu sâu bọ; dung nạp glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Cây dưa	Cây dưa A	NA	Làm chậm quá trình chín/già còi	sam-k
Cây dưa	Cây dưa B	NA	Làm chậm quá trình chín/già còi	sam-k
Cây đu đủ	55-1	CUH-CP551-8	Chống chịu bệnh	prsv cp
Cây đu đủ	63-1	CUH-CP631-7	Chống chịu bệnh	prsv cp
Cây đu đủ	Huanong No. 1	NA	Chống chịu bệnh	prsv rep
Cây đu đủ	X17-2	UFL-X17CP-6	Chống chịu bệnh	prsv cp
Dạ yến thảo	Dạ yến thảo-CHS	NA	Chất lượng sản phẩm được cải thiện	Ức chế CHS
Cây mận	C-5	ARS-PLMC5- 6	Chống chịu bệnh	ppv cp
Cây hạt cải dầu**	ZSR500	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây hạt cải dầu**	ZSR502	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây hạt cải dầu**	ZSR503	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây dương	Bt cây dương	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac; API
Cây dương	Dòng lai cây dương vô tính 741	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac; API
Cây dương	trg300-1		Xenluloza cao	AaXEG2
Cây dương	trg300-2		Xenluloza cao	AaXEG2
Khoai tây	1210 amk	NA	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	2904/1 kgs	NA	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Cây hạt cải dầu**	ZSR500	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây hạt cải dầu**	ZSR502	NA	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Khoai tây	ATBT04-27	NMK-89367-8	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	ATBT04-30	NMK-89613-2	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	ATBT04-31	NMK-89170-9	Chống chịu sâu bọ	cry3A

Khoai tây	ATBT04-36	NMK-89279-1	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	ATBT04-6	NMK-89761-6	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT06	NMK-89812-3	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT10	NMK-89175-5	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT12	NMK-89601-8	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT16	NMK-89167-6	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT17	NMK-89593-9	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT18	NMK-89906-7	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	BT23	NMK-89675-1	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	EH92-527-1	BPS-25271-9	Tinh bột/hydrat cacbon được cải biến	gbss (đối nghĩa)
Khoai tây	HLMT15-15	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-3	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-46	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT15-101	NMK-89653-6	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT21-129	NMK-89684-1	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-152	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-350	NMK-89185-6	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT22-082	NMK-89896-6	Chống chịu bệnh & sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-186	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-238	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-262	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ; Dung nạp glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	SEMT15-02	NMK-89935-9	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-07	NA	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-15	NMK-89930-4	Chống chịu bệnh & sâu bọ	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SPBT02-5	NMK-89576-1	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Khoai tây	SPBT02-7	NMK-89724-5	Chống chịu sâu bọ	cry3A
Cây lúa	7Crp#242-95-7		Chống dị ứng	7crp
Cây lúa	7Crp#10	NA	Chống dị ứng	7crp
Cây lúa	GM Shanyou 63	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab; cry1Ac
Cây lúa	Huahui-1/TT51-1	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab; cry1Ac
Cây lúa	LLCÂY LÚA06	ACS-OS001-4	Dung nạp glufosinat	bar
Cây lúa	LLCÂY LÚA601	BCS-OS003-7	Dung nạp glufosinat	bar
Cây lúa	LLCÂY LÚA62	ACS-OS002-5	Dung nạp glufosinat	bar

Cây lúa	Tarom molaii + cry1Ab	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ab (được làm cùn)
Cây lúa	GAT-OS2		Dung nạp glufosinat	bar
Cây lúa	GAT-OS3		Dung nạp glufosinat	bar
Cây lúa	PE-7		Chống chịu sâu bọ	Cry1Ac
Cây lúa	7Crp#10	NA	Chống dị ứng	7crp
Cây lúa	KPD627-8		Tryptophan cao	OASA1D
Cây lúa	KPD722-4		Tryptophan cao	OASA1D
Cây lúa	KA317		Tryptophan cao	OASA1D
Cây lúa	HW5		Tryptophan cao	OASA1D
Cây lúa	HW1		Tryptophan cao	OASA1D
Cây lúa	B-4-1-18		Lá thẳng đứng cao hơn lùn	Δ OsBRI1
Cây lúa	G-3-3-22		Cao hơn lùn	OSGA2ox1
Cây lúa	AD77		Chống chịu bệnh	DEF
Cây lúa	AD51		Chống chịu bệnh	DEF
Cây lúa	AD48		Chống chịu bệnh	DEF
Cây lúa	AD41		Chống chịu bệnh	DEF
Cây lúa	13pNasNaatAprt1		Dung nạp sắt kẽm	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
Cây lúa	13pAprt1		Dung nạp sắt kẽm	APRT
Cây lúa	gHvNAS1-gHvNAAT-1		Dung nạp sắt kẽm	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
Cây lúa	gHvIDS3-1		Dung nạp sắt kẽm	HvIDS3
Cây lúa	gHvNAAT1		Dung nạp sắt kẽm	HvNAAT-A; HvNAAT-B
Cây lúa	gHvNAS1-1		Dung nạp sắt kẽm	HvNAS1
Cây lúa	NIA-OS006-4		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	NIA-OS005-3		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	NIA-OS004-2		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	NIA-OS003-1		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	NIA-OS002-9		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	NIA-OS001-8		Chống chịu bệnh	WRKY45
Cây lúa	OsCr11		Chống dị ứng	Được cải biến
Cây lúa	17053		Dung nạp glyphosat	Cry j
Cây lúa	17314		Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây hoa hồng	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	Màu sắc hoa biến đổi	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây hoa hồng	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	Màu sắc hoa biến đổi	5AT; bp40 (f3'5'h)
Đậu tương	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	Dầu/axit béo được cải biến	5AT; bp40 (f3'5'h)
Đậu tương	A2704-12	ACS-GM005-3	Dung nạp glufosinat	gm-fad2-1 (locut cam)
Đậu tương	A2704-21	ACS-GM004-	Dung nạp glufosinat	pat

		2		
Đậu tương	A5547-127	ACS-GM006-4	Dung nạp glufosinat	pat
Đậu tương	A5547-35	ACS-GM008-6	Dung nạp glufosinat	pat
Đậu tương	CV127	BPS-CV127-9	Chịu Imidazolinon	csr1-2
Đậu tương	DAS68416-4	DAS68416-4	Dung nạp glufosinat	pat
Đậu tương	DP305423	DP-305423-1	Dầu/axit béo được cải biến; Dung nạp thuốc diệt cỏ ALS	gm-fad2-1 (locut câm); gm-hra
Đậu tương	DP356043	DP-356043-5	Dầu/axit béo được cải biến; Dung nạp glyphosat	gm-fad2-1 (locut câm); gat4601
Đậu tương	FG72	MST-FG072-3	Dung nạp Glyphosat & HPPD	2mepsps; hppdPF W336
Đậu tương	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	GU262	ACS-GM003-1	Dung nạp glufosinat	pat
Đậu tương	MON87701	MON-87701-2	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Đậu tương	MON87705	MON-87705-6	Dầu/axit béo được cải biến; Dung nạp glyphosat	fatb1-A (có nghĩa & đối nghĩa); fad2-1A (có nghĩa & đối nghĩa); cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON87708	MON-87708-9	Dicamba & Dung nạp glyphosat	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON87769	MON-87769-7	Dầu/axit béo được cải biến; Dung nạp glyphosat	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON89788	MON-89788-1	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	W62	ACS-GM002-9	Dung nạp glufosinat	bar
Đậu tương	W98	ACS-GM001-8	Dung nạp glufosinat	bar
Đậu tương	MON87754	MON-87754-1	Lượng dầu cao	dgat2A
Đậu tương	DAS21606	DAS-21606	Chịu Aryloxyalkanoat & glufosinat	aad-12; pat cải biến
Đậu tương	DAS44406	DAS-44406-6	Aryloxyalkanoate, glyphosat & dung nạp glufosinat	aad-12; 2mepsps; pat cải biến
Đậu tương	SYHT04R	SYN-0004R-8	Dung nạp mesotrion	avhppd cải biến
Đậu tương	9582.814.19.1		Chống chịu sâu bọ & dung nạp glufosinat	cry1Ac, cry1F, PAT
Cây bí	CZW3	SEM-ØCZW3-2	Chống chịu bệnh	cmv cp, zymv cp, wmv cp
Cây bí	ZW20	SEM-ØZW20-7	Chống chịu bệnh	zymv cp, wmv cp
Cây củ cải đường	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây củ cải đường	H7-1	KM-000H71-4	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cây củ cải đường	T120-7	ACS-BV001-3	Dung nạp glufosinat	pat
Cây củ cải đường	T227-1		Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

Cây mía	NXI-1T		Chịu hạn	EcbetA
Cây hoa hướng dương	X81359		Chịu Imidazolinon	als
Cây ớt ngọt	PK-SP01	NA	Chống chịu bệnh	cmv cp
Cây thuốc lá	C/F/93/08-02	NA	Chống chịu Oxynil	bxn
Cây thuốc lá	Vật truyền 21-41	NA	Hàm lượng nicotin giảm	NtQPT1 (đối nghĩa)
Cây cà chua	1345-4	NA	Làm chậm quá trình chín/già cỗi	acc (được làm cùn)
Cây cà chua	35-1-N	NA	Làm chậm quá trình chín/già cỗi	sam-k
Cây cà chua	5345	NA	Chống chịu sâu bọ	cry1Ac
Cây cà chua	8338	CGN-89322-3	Chậm quá trình chín/già cỗi	accd
Cây cà chua	B	SYN-0000B-6	Chậm quá trình chín/già cỗi	pg (có nghĩa hoặc đối nghĩa)
Cây cà chua	Da	SYN-0000DA-9	Chậm quá trình chín/già cỗi	pg (có nghĩa hoặc đối nghĩa)
Cây hoa hướng dương	X81359		Chịu Imidazolinon	Als
Cây cà chua	Da Dong No 9	NA	Được cải biến sản phẩm	NA
Cây cà chua	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	Chậm quá trình chín/già cỗi	pg (có nghĩa hoặc đối nghĩa)
Cây cà chua	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Làm chậm quá trình chín/già cỗi	pg (có nghĩa hoặc đối nghĩa)
Cây cà chua	Huafan No 1	NA	Làm chậm quá trình chín/già cỗi	anti-efe
Cây cà chua	PK-TM8805R (8805R)	NA	Chống chịu bệnh	cmv cp
Cây lúa mì	MON71800	MON-71800-3	Dung nạp glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

* Ác-hen-ti-na, ** Ba lan, # Cây cà tím

Xử lý cây trồng và hạt giống biến đổi gen bằng hợp chất theo sáng chế có thể tạo ra tác dụng siêu cộng hợp hoặc tác dụng hiệp đồng. Ví dụ, việc giảm tỷ lệ rụng, mở rộng phổ tác dụng, tăng mức dung nạp các sức ép sinh học/không sinh học hoặc tăng độ ổn định bảo quản có thể lớn hơn mong đợi so với khi tác dụng cộng hợp đơn thuần khi dùng hợp chất theo sáng chế lên cây trồng và hạt giống biến đổi gen.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể sử dụng để xử lý hạt để bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống. Trong bản mô tả này, xử lý hạt tức là cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo sáng chế mà thường được điều chế dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Việc xử lý hạt này bảo vệ hạt khỏi loài gây hại không xương sống trong đất và còn có thể bảo vệ rễ và các bộ phận

khác của cây khi tiếp xúc với đất mà hạt nảy mầm phát triển. Việc xử lý hạt có thể cũng có tác dụng bảo vệ lá bằng cách hoán chuyển hợp chất theo sáng chế hoặc hoạt chất thứ hai trong cây đang phát triển. Phương pháp xử lý hạt có thể được áp dụng đối với tất cả các loại hạt, bao gồm hạt của thực vật được biến đổi gen để biểu hiện các tính trạng đặc biệt sẽ nảy mầm. Ví dụ đại diện về các hạt này bao gồm hạt biểu hiện độc tố protein với các loài gây hại không xương sống, như độc tố *Bacillus thuringiensis* hoặc hạt biểu hiện tính chống chịu thuốc diệt cỏ như glyphosat axetyltransferaza, mà tạo ra tính kháng glyphosat. Việc xử lý hạt bằng hợp chất theo sáng chế cũng có thể làm tăng sức sống của cây trồng sinh trưởng từ hạt.

Một phương pháp xử lý hạt là phun hoặc rắc bụi lên hạt với chế phẩm theo sáng chế (tức là dưới dạng chế phẩm được điều chế) trước khi gieo hạt. Chế phẩm được điều chế để xử lý hạt thường chứa chất tạo màng hoặc chất kết dính. Do đó, thông thường chế phẩm phủ hạt theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, *N*-oxit hoặc muối của chúng và chất tạo màng hoặc chất kết dính. Hạt có thể được phủ bằng cách phun huyền phù đặc dễ chảy trực tiếp vào trống quay chứa hạt và sau đó sấy khô hạt này. Theo cách khác, các dạng chế phẩm khác như bột thấm ướt, dung dịch, nhũ tương huyền phù, chất cô đặc dễ nhũ hoá và nhũ tương trong nước có thể được phun lên hạt. Quy trình này là đặc biệt hữu ích để tạo ra lớp màng phủ lên hạt. Các thiết bị phủ và các quy trình khác nhau có thể sẵn có đối với người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này. Các quy trình thích hợp bao gồm các quy trình được nêu trong P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress và Prospects*, 1994 BCPC Mongraph số 57 và các tài liệu tham khảo được nêu trong đó.

Hợp chất có công thức 1 và chế phẩm của chúng, cả riêng biệt và kết hợp với các thuốc trừ sâu, thuốc diệt giun tròn, và thuốc diệt nấm khác, là đặc biệt hữu ích trong xử lý hạt cho cây trồng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, ngô hoặc ngô, đậu tương, bông, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và cây lúa), khoai tây, các loại rau và cây cải dầu.

Thuốc trừ sâu khác mà hợp chất có công thức 1 có thể được điều chế để tạo ra hỗn hợp hữu ích để xử lý hạt bao gồm abamectin, axetamiprit, acrinathrin,

amitraz, avermectin, azadiractin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, chlorantraniliprole, clorfenapyr, clopyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flonicamit, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazate, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprit, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiodicarb, metomyl, metoprene, metoxyfenozit, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodin, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflo, tebufenozit, tetramethrin, thiachloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumuron, nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*, tất cả các chủng *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng virus nhiều mặt nhân.

Thuốc diệt nấm mà hợp chất có công thức 1 có thể được bào chế cùng để tạo ra hỗn hợp hữu ích để xử lý hạt bao gồm amisulbrom, azoxystrobin, boscalid, carbendazim, carboxin, xymoxanil, cyproconazol, difenoconazol, dimetomorph, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolide, fluoxastrobin, flutriafol, fluxapyroxad, ipconazol, iprodion, metalaxyl, mefenoxam, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penflufen, picoxystrobin, prothioconazol, pyraclostrobin, sedaxane, silthiofam, tebuconazol, thiabendazol, thiophanat-metyl, thiram, trifloxystrobin và triticonazol.

Chế phẩm chứa hợp chất có công thức 1 hữu ích để xử lý hạt cần còn bao gồm vi khuẩn và nấm có khả năng tạo ra sự bảo vệ tránh khỏi các tác động có hại của nấm hoặc vi khuẩn gây bệnh cây và/hoặc động vật sống trong đất như giun tròn. Vi khuẩn có đặc tính diệt giun tròn có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* và *Pasteuria penetrans*. Chủng *Bacillus firmus* thích hợp là chủng CNCM I-1582 (GB-126) là sản phẩm có dưới tên thương mại BioNemTM. Chủng *Bacillus cereus* thích hợp là chủng NCMM I-1592. Cả hai chủng *Bacillus* đều được đề cập trong patent Mỹ số US 6,406,690.

Các chủng vi khuẩn khác thích hợp có hoạt tính diệt giun tròn là *B. amyloliquefaciens* IN937a và *B. subtilis* strain GB03. Vi khuẩn có đặc tính diệt nấm có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chủng *B. pumilus* GB34. Các loài nấm có đặc tính diệt giun tròn có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chủng *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* và *Purpureocillium lilacinum*.

Các chất xử lý hạt cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều chất diệt giun tròn có nguồn gốc tự nhiên như chất sinh ra protein được gọi là harpin được tách ra từ mầm bệnh thực vật của một số vi khuẩn như *Erwinia amylovora*. Một ví dụ là công nghệ xử lý hạt Harpin-N-Tek sẵn có dưới tên thương mại N-Hibit™ Gold CST.

Xử lý hạt cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều loài vi khuẩn gây nốt sần quả-rễ của cây họ đậu như vi khuẩn cố định nitơ vi cộng sinh nitơ *Bradyrhizobium japonicum*. Các chất chủng ngừa có thể tùy ý là một hoặc nhiều lipo-chitoooligosacarit (LCO), là các yếu tố tạo nốt sần (Nod) được sản xuất bởi vi khuẩn rhizobia trong quá trình hơi mào tạo thành nốt sần trên rễ của cây họ đậu. Ví dụ, công nghệ xử lý hạt của nhãn hiệu Optimize® đưa vào chất trợ xúc tác LCO Technology™ kết hợp với chất chủng ngừa.

Xử lý hạt cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều isoflavones có thể làm tăng mức rễ colonization by nấm mycorrhizal. Nấm Mycorrhizal làm tăng sự sinh trưởng thực vật bằng cách làm tăng mức hấp thụ chất dinh dưỡng như nước, sulfat, nitrat, phosphat và kim loại của rễ. Ví dụ về isoflavones bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, genistein, biochanin A, formononetin, daidzein, glycitein, hesperetin, naringenin và pratensein. Formononetin sẵn có dưới dạng hoạt chất trong sản phẩm chủng ngừa mycorrhizal như PHC Colonize® AG.

Chất xử lý hạt cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều chất hoạt hóa thực vật là chất tạo ra hệ thống kháng tập nhiễm ở thực vật sau khi tiếp xúc với mầm bệnh. Một ví dụ về chất hoạt hóa thực vật tạo ra cơ chế bảo vệ như vậy là acibenzolar-S-metyl.

Hạt đã xử lý thường chứa hợp chất theo sáng chế với lượng nằm trong khoảng từ 0,1g đến 1 kg cho 100 kg hạt (tức là nằm trong khoảng từ 0,0001 đến

1% khối lượng hạt trước khi xử lý). Huyền phù dễ chảy được điều chế để xử lý hạt thường chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 70%, chất kết dính tạo màng với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 30%, chất phân tán với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 20%, chất cô đặc với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, bột màu và/hoặc thuốc nhuộm với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, chất chống tạo bọt với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 2%, chất bảo quản với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 1% và chất pha loãng lỏng dễ bay hơi với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 75%.

Hộp chất theo sáng chế có thể được đưa vào vào chế phẩm môi để các loài gây hại không xương sống ăn hoặc được sử dụng trong các dụng cụ như bẫy, môi, và các dụng cụ tương tự. Chế phẩm môi như vậy có thể ở dạng hạt chứa (a) hoạt chất, cụ thể là lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó; (b) một hoặc nhiều nguyên liệu thức ăn; (c) chất dẫn dụ, và tùy ý (d) một hoặc nhiều chất giữ ẩm. Tốt hơn là, hạt hoặc chế phẩm môi chứa từ 0,001% đến 5% hoạt chất, từ 40% đến 99% nguyên liệu thức ăn và/hoặc chất dẫn dụ; và tùy ý từ 0,05% đến 10% chất giữ ẩm, là hữu hiệu để phòng trừ các loài gây hại không xương sống trong đất ở các tỷ lệ dùng rất thấp, cụ thể là ở các liều lượng hoạt chất gây chết bằng cách ăn chứ không phải bằng cách tiếp xúc trực tiếp. Một số nguyên liệu thức ăn có thể đóng vai trò vừa làm nguồn thức ăn vừa làm chất dẫn dụ. Nguyên liệu thức ăn bao gồm carbohydrat, protein và lipit. Ví dụ về nguyên liệu thức ăn là bột mỳ thực vật, đường, tinh bột, mỡ động vật, dầu thực vật, dịch chiết nấm và sữa rắn. Ví dụ về chất dẫn dụ là chất thơm và chất tạo hương, như dịch chiết quả hoặc thực vật, hương thơm, hoặc các thành phần động vật hoặc thực vật khác, pheromon hoặc chất khác đã biết để dẫn dụ các loài gây hại không xương sống. Ví dụ về chất giữ ẩm, tức là chất giữ độ ẩm, là glycol và các polyol khác, glyxerin và sorbitol. Tốt hơn là, chế phẩm môi (và phương pháp sử dụng chế phẩm môi này) được sử dụng để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm kiến, mối và gián. Dụng cụ để phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể bao gồm chế phẩm môi theo sáng chế và hộp phù hợp để chứa chế phẩm môi này, trong đó hộp này có ít nhất một lỗ hổng có độ lớn nhất định để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua sao

cho loài gây hại không xương sống này có thể lấy được chế phẩm môi từ địa điểm bên ngoài hộp, và hộp này còn phù hợp để được đặt trong hoặc gần khu vực hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Một phương án của sáng chế là phương pháp phòng trừ các loài gây hại không xương sống, bao gồm bước pha loãng chế phẩm trừ sâu theo sáng chế (hợp chất có công thức 1 được điều chế với chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng hoặc hỗn hợp đã điều chế chứa hợp chất có công thức 1 và ít nhất một khác thuốc trừ sâu) bằng nước, và tùy ý bổ sung chất hỗ trợ để tạo ra chế phẩm pha loãng, và cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của chế phẩm pha loãng này.

Mặc dù chế phẩm phun được điều chế bằng cách pha loãng bằng nước đến nồng độ đủ của chế phẩm trừ sâu theo sáng chế để có thể tạo ra hiệu quả đủ để phòng trừ các loài gây hại không xương sống, các sản phẩm hỗ trợ được điều chế riêng rẽ cũng có thể được bổ sung vào hỗn hợp thùng phun. Các chất hỗ trợ bổ sung này thường được gọi là “chất hỗ trợ phun” hoặc “chất hỗ trợ hỗn hợp thùng phun”, và bao gồm chất bất kỳ được trộn trong thùng phun để làm tăng tính năng của thuốc sâu hoặc thay đổi các đặc tính vật lý của hỗn hợp phun. Chất hỗ trợ có thể là chất hoạt động bề mặt, chất nhũ hóa, dầu cây trồng nền dầu mỡ, dầu hạt có nguồn gốc từ cây trồng, chất axit hóa, chất đệm, chất làm đặc hoặc chất khử bọt. Chất hỗ trợ được sử dụng để làm tăng hiệu quả (ví dụ, tính sinh khả dụng, sự bám dính, sự thẩm thấu, độ che phủ đồng đều và thời gian bảo vệ), hoặc làm giảm tới mức tối thiểu hoặc khử bỏ các nhược điểm khi phun liên quan đến độ không tương hợp, hiện tượng tạo bọt, hiện tượng trôi, làm bay hơi, sự bốc hơi, sự bay hơi và sự suy biến. Để thu được tính năng tối ưu, chất hỗ trợ được chọn liên quan đến các đặc tính của hoạt chất, chế phẩm và đích cần phòng trừ (ví dụ, cây trồng, các loài sâu bọ gây hại).

Trong số các chất hỗ trợ phun, dầu bao gồm dầu thực vật, dầu thực vật cô đặc, dầu rau cô đặc và dầu hạt cô đặc được metyl hóa thường được sử dụng để làm tăng hiệu quả của thuốc trừ sâu, có thể bằng các phương tiện thúc đẩy mức lắng phủ đồng đều hơn nữa. Trong các trường hợp mà tại đó độc tố thực vật có khả năng gây ra bởi dầu hoặc các chất lỏng khác không thể trộn lẫn với nước được

quan tâm, chế phẩm phun được điều chế từ chế phẩm theo sáng chế thường sẽ không chứa chất bổ trợ phun nền dầu. Tuy nhiên, trong các trường hợp mà tại đó độc tố thực vật bị gây ra bởi chất bổ trợ phun nền dầu là không đáng kể về mặt thương mại, chế phẩm phun được điều chế từ chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa chất bổ trợ phun nền dầu, mà có thể làm tăng hơn nữa mức phòng trừ các loài gây hại không xương sống, cũng như việc không bị rửa trôi bởi nước mưa.

Sản phẩm được xác định là “dầu cây trồng” thường chứa 95 đến 98% dầu mỏ trên cơ sở parafin hoặc naphta và 1 đến 2% một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt hoạt động như chất nhũ hóa. Sản phẩm được xác định là “dầu cây trồng dạng cô đặc” thường chứa 80 đến 85% dầu nền dầu mỏ dễ nhũ hóa và 15 đến 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Sản phẩm được xác định đúng là “dầu thực vật dạng cô đặc” thường chứa 80 đến 85% dầu thực vật (tức là dầu hạt hoặc dầu quả, hầu hết thường từ bông, hạt lanh, đậu tương hoặc cây hoa hướng dương) và 15 đến 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Tính năng bổ trợ có thể được cải thiện bằng cách thay thế dầu thực vật bằng các este metyl của axit béo mà thường có nguồn gốc từ dầu thực vật. Ví dụ về dầu hạt cô đặc được metyl hóa bao gồm MSO® Concentrate (UAP-Loveland Products, Inc.) and Premium MSO Methylated Spray Oil (Helena Chemical Company).

Lượng chất bổ trợ được bổ sung vào hỗn hợp phun thường không vượt quá 2,5% theo thể tích, và tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,1 đến 1% theo thể tích. Tỷ lệ dùng chất bổ trợ được bổ sung vào hỗn hợp phun thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5L cho mỗi hecta. Ví dụ đại diện về chất bổ trợ phun bao gồm: Adigor® (Syngenta) 47% dầu hạt cải dầu được metyl hóa trong hydrocacbon lỏng, Silwet® (Helena Chemical Company) heptametyltrisiloxan được cải biến polyalkylenoxit và Assist® (BASF) 17% hỗn hợp chất hoạt động bề mặt trong 83% dầu khoáng trên cơ sở parafin.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được dùng mà không cần chất bổ trợ khác, nhưng phần lớn các trường hợp là dùng chế phẩm chứa một hoặc nhiều hoạt chất với chất mang, chất pha loãng, và chất hoạt động bề mặt thích hợp và có thể kết hợp với thức ăn tùy thuộc vào mục đích sử dụng cuối cùng. Một phương pháp

dùng là phun chất phân tán nước hoặc dung dịch dầu tinh chế chứa hợp chất theo sáng chế. Việc kết hợp với dầu phun, dầu phun cô đặc, chất dính phát tán, chất hỗ trợ, các dung môi khác, và chất hiệp đồng như piperonyl butoxit thường làm tăng hiệu quả của hợp chất. Đối với các mục đích phi nông nghiệp, việc phun này có thể được thực hiện bằng các dụng cụ chứa như bình, chai hoặc các đồ chứa khác, bằng cách bơm hoặc giải phóng chế phẩm phun ra khỏi dụng cụ chứa tăng áp, ví dụ, bình phun sol khí tăng áp. Các chế phẩm phun này có thể ở nhiều dạng khác nhau, ví dụ, dạng phun, dạng mù, dạng bột, dạng khối hoặc dạng sương mù. Do đó, các chế phẩm phun này còn có thể chứa chất khí đẩy, chất tạo bột, v...v. khi cần. Tốt hơn là, chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất mang. Theo một phương án, chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất khí đẩy. Ví dụ về chất khí đẩy bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, metan, etan, propan, butan, isobutan, buten, pentan, isopentan, neopentan, penten, hydroflocacbon, cloflocacbon, dimetyl ete, và hỗn hợp của chất nêu trên. Tốt hơn là, chế phẩm phun (và phương pháp sử dụng chế phẩm phun được phân tán từ thùng phun) được sử dụng ở dạng riêng lẻ hoặc kết hợp để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm muỗi, ruồi đen, ruồi chó, ruồi châu Mỹ, ruồi ngựa, ong bắp cày, ong bắp cày đen và vàng, ve, nhện, kiến, muỗi mắt, và các loài động vật gây hại tương tự, bao gồm ở dạng riêng rẽ hoặc kết hợp.

Các ứng dụng phi nông nghiệp bao gồm bảo vệ động vật, cụ thể là động vật không xương sống, cụ thể hơn là động vật không xương sống máu nóng (ví dụ, động vật có vú hoặc chim) khỏi loài gây hại ký sinh không xương sống, bao gồm bước cho động vật cần được bảo vệ dùng lượng có tác dụng diệt ký sinh trùng (tức là lượng hữu hiệu sinh học) của hợp chất theo sáng chế, thường ở dạng chế phẩm được bào chế để dùng trong thú y. Khi được đề cập trong bản mô tả và phần yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ “diệt ký sinh trùng” và “có tác dụng diệt ký sinh trùng” dùng để chỉ hiệu quả quan sát được trên loài gây hại ký sinh trùng không xương sống để thu được việc bảo vệ động vật khỏi loài gây hại này. Tác dụng diệt ký sinh trùng thường dùng để chỉ việc làm giảm sự xuất hiện hoặc tác động của loài

gây hại ký sinh không xương sống đích. Các tác dụng như vậy đối với loài gây hại bao gồm gây chết hoại, tiêu diệt, làm chậm sự phát triển, làm giảm khả năng vận động hoặc khả năng tồn tại trên hoặc trong vật chủ, làm giảm việc nạp ăn và ức chế quá trình sinh sản. Các tác dụng này đối với loài gây hại ký sinh không xương sống tạo ra hiệu quả phòng trừ (bao gồm ngăn ngừa, làm giảm hoặc hạn chế) sự quấy phá hoặc nhiễm ký sinh của động vật. Ví dụ về loài ký sinh không xương sống phòng trừ được bằng cách cho động vật cần bảo vệ bao gồm loài ngoại ký sinh (động vật chân đốt, ve bét, v.v.) và loài nội ký sinh (giun sán, ví dụ, giun tròn, sán lá, sán dây, bọ đầu gai, v.v.) dùng lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo sáng chế. Đặc biệt là, chế phẩm theo sáng chế là hữu hiệu chống lại loài ngoại ký sinh bao gồm: ruồi như *Haematobia (Lyperosia) irritans* (horn fly), *Stomoxys calcitrans* (ruồi chó), *Simulium* spp. (ruồi đen), *Glossina* spp. (ruồi tê xê), *Hydrotaea irritans* (ruồi đầu), *Musca autumnalis* (ruồi mắt), *Musca domestica* (ruồi nhà), *Morellia simplex* (ruồi hôi), *Tabanus* spp. (ruồi ngựa), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (nhặng xanh), *Calliphora* spp. (nhặng), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (ruồi trâu mui), *Culicoides* spp. (muỗi vằn), *Hippobosca equina*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* và *Gastrophilus nasalis*; chấy như *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* và *Trichodectes canis*; con mòng như *Melophagus ovinus*; bét như *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. và *Otodectes xyanotis* (bét tai); ve như *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. và *Haemaphysalis* spp.; và bọ chột như *Ctenocephalogenus felis* (bọ chột mèo) và *Ctenocephalogenus canis* (bọ chột chó).

Các ứng dụng phi nông nghiệp trong lĩnh vực thú y được dùng theo cách thông thường như dùng qua đường tiêu hoá ở dạng, ví dụ, viên nén, viên nang, dạng lỏng, dạng ngậm, dạng hạt, hỗn hợp nhão, dạng viên lớn, dạng ngậm qua thức ăn, dạng viên thuốc đạn, dùng ngoài đường tiêu hoá như bằng cách tiêm (trong cơ, dưới da, trong tĩnh mạch, trong bụng), được cấy vào cơ thể; dùng qua

đường mũi, dùng qua da dưới dạng, ví dụ, ngâm nhúng, phun, giội và chấm lên, rửa, rắc bột, và với sự trợ giúp của những vật phẩm chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế như vòng đeo cổ, nhẫn đeo tai, nhẫn gắn vào đuôi, vòng đeo chân hoặc dây treo hoặc vật đánh dấu.

Thông thường, chế phẩm diệt ký sinh trùng theo sáng chế chứa hỗn hợp bao gồm hợp chất có công thức 1, N-oxit hoặc muối của chúng với một hoặc nhiều chất mang được dụng hoặc dùng được trong thú y chứa tá dược và chất bổ trợ được chọn theo cách dùng mong muốn (ví dụ, dùng qua đường miệng, khu trú hoặc ngoài đường tiêu hoá như tiêm) và theo tiêu chuẩn. Ngoài ra, chất mang thích hợp được chọn trên cơ sở độ tương thích với một hoặc nhiều hoạt chất trong chế phẩm, bao gồm xem xét độ ổn định theo pH và hàm lượng ẩm. Vì vậy, tốt hơn nếu chế phẩm bảo vệ động vật khỏi loài gây hại ký sinh không xương sống chứa lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo sáng chế và ít nhất một chất mang.

Để dùng ngoài đường tiêu hoá bao gồm dùng trong tĩnh mạch, trong bắp và tiêm dưới da, hợp chất theo sáng chế có thể được pha chế vào hỗn dịch, dung dịch hoặc nhũ tương trong chất dẫn dầu hoặc nước và có thể chứa chất bổ trợ như chất tạo hỗn dịch, chất làm ổn định và/hoặc chất phân tán. Dược phẩm tiêm bao gồm dung dịch nước chứa dạng hoạt chất tan được trong nước (ví dụ, muối chứa hoạt chất), tốt hơn là trong dung dịch đệm tương hợp với cơ thể chứa tá dược hoặc chất bổ trợ khác đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật bào chế được.

Để dùng qua đường miệng ở dạng dung dịch (phần lớn ở dạng có thể hấp thu dễ dàng), nhũ tương, hỗn dịch, bột nhão, gel, viên nang, viên nén, viên liều cao, bột, hạt, chất ức chế lưu giữ trong dạ cọ và thức ăn/nước nước/khối liếm, hợp chất theo sáng chế có thể được điều chế với chất gắn kết/chất độn đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này thích hợp cho chế phẩm dùng qua đường miệng như đường (ví dụ, lactoza, sucroza, manitol, sorbitol), tinh bột (ví dụ, tinh bột ngô, tinh bột lúa mì, tinh bột gạo, tinh bột khoai tây), xenluloza và các dẫn xuất (ví dụ, metylxenluloza, carboxymetylxenluloza, etylhydroxyxenluloza), dẫn xuất protein (ví dụ, zein, gelatin) và các polyme tổng hợp (ví dụ, rượu polyvinyllic, polyvinylpyrrolidon). Nếu muốn, chất bôi trơn (ví dụ, magie stearat), chất gây rã

(ví dụ, polyvinylpyrrolidinon liên kết ngang, thạch, axit alginic) và thuốc nhuộm hoặc bột màu có thể được bổ sung vào. Bột nhão và gel cũng thường chứa chất kết dính (ví dụ, acaxia, axit alginic, bentonit, xenluloza, gôm xanthan, magie nhôm silicat dạng keo) nhằm giữ chế phẩm tiếp xúc với khoang miệng và không bị đẩy ra một cách dễ dàng.

Nếu chế phẩm diệt ký sinh trùng ở thức ăn cô đặc, chất mang thường được chọn từ thức ăn cô đặc hiệu suất cao, thức ăn ngũ cốc cô đặc hoặc protein cô đặc. Chế phẩm chứa chất cô đặc như vậy có thể chứa, ngoài hoạt chất diệt ký sinh trùng, chất phụ gia tăng cường sức khoẻ hoặc sự phát triển động vật, cải thiện chất lượng thịt cho các động vật lấy thịt hoặc có thể sử dụng cho gia súc. Chất phụ gia này có thể bao gồm, ví dụ, vitamin, thuốc kháng sinh, hoá trị liệu, thuốc kháng vi khuẩn, thuốc kháng nấm, thuốc kháng cầu trùng và hormon.

Đã phát hiện ra hợp chất theo sáng chế có đặc tính dược lý và dược động học thích hợp để tạo ra khả năng dung nạp toàn thân khi dùng và nuốt qua đường miệng. Do đó, sau khi động vật được bảo vệ nuốt hợp chất này, nồng độ các tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo sáng chế trong dòng máu bảo vệ động vật đã được xử lý khỏi loài gây hại bằng cách hút máu như bọ chét, ve và chấy. Vì vậy, tốt hơn là chế phẩm để bảo vệ động vật khỏi loài gây hại ký sinh không xương sống ở dạng dễ dùng qua đường miệng (tức là chứa, ngoài lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo sáng chế, một hoặc nhiều chất mang được chọn từ chất gắn kết và chất độn thích hợp để dùng qua đường miệng và thức ăn dạng chất mang cô đặc).

Chế phẩm để dùng khu trú thường ở dạng bột, kem, hỗn dịch, thuốc xịt, nhũ tương, bọt, bột nhão, sol khí, thuốc mỡ, sáp hoặc gel. Tốt hơn là, chế phẩm khu trú là dung dịch hòa tan trong nước, có thể ở dạng chất cô đặc được pha loãng trước khi sử dụng. Chế phẩm diệt ký sinh trùng thích hợp để dùng khu trú chứa hợp chất theo sáng chế và một hoặc nhiều chất mang thích hợp để dùng khu trú. Khi dùng khu trú chế phẩm diệt ký sinh trùng cho phần bên ngoài động vật dưới dạng vạch hoặc điểm (tức là xử lý “tùng điểm”), hoạt chất thâm nhập lên bề mặt của cơ thể động vật để phủ hầu hết hoặc toàn bộ diện tích bề mặt ngoài của nó. Kết quả là, động vật đã được xử lý được bảo vệ đặc biệt khỏi loài gây hại

không xương sống mà ăn da của động vật như ve, bọ chét và chấy. Do đó, chế phẩm để dùng khu trú thường chứa ít nhất một dung môi hữu cơ để vận chuyển hoạt chất dễ dàng qua da và/hoặc thấm vào da của động vật. Dung môi thường được sử dụng làm chất mang trong các chế phẩm như vậy bao gồm propylen glycol, parafin, chất thơm, este như isopropyl myristat, glycol ete, và rượu như etanol và *n*-propanol.

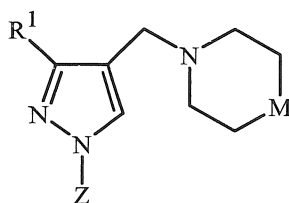
Tỷ lệ dùng cần để phòng trừ hiệu quả (tức là "lượng hữu hiệu sinh học") sẽ phụ thuộc vào các yếu tố như loài gây hại không xương sống cần phòng trừ, vòng đời của loài gây hại, giai đoạn sống, kích thước của nó, nơi sống, thời gian trong năm, cây trồng hoặc động vật chủ, tập tính ăn, tập tính giao phối, độ ẩm xung quanh, nhiệt độ, và các yếu tố tương tự. Trong trường hợp bình thường, tỷ lệ dùng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 2 kg hoạt chất cho mỗi hecta là đủ để phòng trừ các loài gây hại trong hệ sinh thái nông nghiệp, nhưng có khi chỉ cần với tỷ lệ nhỏ 0,0001 kg/hecta là đủ hoặc có thể cần đến tỷ lệ 8 kg/hecta mới đủ. Đối với các lĩnh vực phi nông nghiệp, tỷ lệ dùng hữu hiệu sẽ nằm trong khoảng từ 1,0 đến 50 mg/m² nhưng có khi chỉ cần với tỷ lệ nhỏ 0,1 mg/m² là đủ hoặc có thể cần với tỷ lệ đến 150 mg/m² mới đủ. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể dễ dàng xác định được lượng hữu hiệu sinh học cần thiết để thu được hiệu quả phòng trừ loài gây hại không xương sống mong muốn.

Nói chung, để sử dụng trong thú y, hợp chất có công thức I, N-oxit hoặc muối của nó được dùng với lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng cho động vật cần được bảo vệ khỏi loài gây hại ký sinh không xương sống. Lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng là lượng hoạt chất cần thiết để thu được hiệu quả làm giảm sự xuất hiện hoặc hoạt tính của loài gây hại ký sinh không xương sống đích nhìn thấy được. Người có hiểu biết trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ đánh giá được rằng lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng có thể thay đổi đối với các hợp chất và chế phẩm khác nhau theo sáng chế, tác dụng và thời gian diệt ký sinh trùng mong muốn, loài gây hại không xương sống đích, động vật cần được bảo vệ, kiểu dùng và các yếu tố khác và lượng cần thiết để thu được kết quả cụ thể có thể được xác định bằng các thử nghiệm đơn giản.

Để dùng qua đường miệng cho động vật máu nóng, liều lượng hằng ngày của hợp chất theo sáng chế thường nằm trong khoảng từ 0,01mg/kg đến 100mg/kg, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,5mg/kg đến 100mg/kg, thể trọng động vật. Để dùng khu trú (ví dụ, cho da), chế phẩm nhúng và phun theo sáng chế thường chứa từ 0,5ppm đến 5000ppm, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1ppm đến 3000ppm.

Hợp chất theo sáng chế được điều chế bằng các phương pháp được mô tả ở đây là như được thể hiện trong Bảng chỉ số A–C. Đối với dữ liệu phổ khối (MS), giá trị bằng số được báo cáo là phân tử lượng của ion bố mẹ đồng vị cao nhất (M+1) được tạo thành bằng cách bổ sung H⁺ (phân tử lượng bằng 1) và phân tử, quan sát được bằng phép phân tích phổ khối sử dụng quá trình ion hoá hóa học tại áp suất khí quyển (AP⁺). Các từ viết tắt sau được sử dụng trong Bảng chỉ số là như sau: Cmpd nghĩa là hợp chất, *t* là bậc ba, *c* là xyclo, Me là metyl, Et là etyl, Pr là propyl, *i*-Pr là isopropyl, Bu là butyl, *c*-Pr là xyclopropyl, *c*-Pn là xyclopentyl, *c*-Hx là xyclohexyl, *t*-Bu là *tertiary*-butyl, Ph là phenyl, OMe là metoxy, SMe là methylthio, và SO₂Me nghĩa là methylsulfonyl. (*R*) hoặc (*S*) biểu thị sự bất đối xứng tuyệt đối của trung tâm cacbon bất đối xứng. Từ viết tắt “Ví dụ” dùng để chỉ “Ví dụ” và tiếp đó là con số mà hợp chất của Ví dụ tổng hợp được điều chế.

Bảng chỉ số A



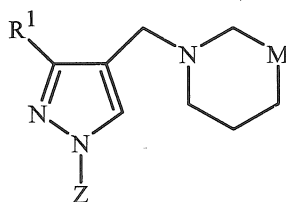
<u>Hợp chất số</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>M</u>	<u>MS hoặc MP</u>
1	-CH ₂ (2-flophenyl)	3,4-điclophenyl	CH(CN)	443,1
2	-CH ₂ (4-flophenyl)	3,4-điclophenyl	CH(CN)	443,1
4	-CH ₂ (2-flophenyl)	4-clophenyl	CH(CN)	409,4
5	-CH ₂ (2-flophenyl)	4-clophenyl	CH(NHC(O)Me)	441,2
8	-CH ₂ (2-flophenyl)	4-clophenyl	O	386,4
9	-CH=CHCl	4-clophenyl	CH(CN)	361,0

10	-CH=CHCl	4-clophenyl	CH(NHC(O)Me)	393,0
11	-CH=CHCl	4-clophenyl	O	338,0
12	xyclopropyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	375,3
14	Etyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	71-73
15	-CH=CH ₂	3,4-diclophenyl	CH(CN)	88-90
16	-CHCl ₂	3-clo-4-flophenyl	CH(CN)	401,0
17	-CHF ₂	3-clo-4-flophenyl	CH(CN)	369,5
18	2,2-diclo-1-xyclopropyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	445,3
19	xyclohexyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	153-156
21	Metyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	125-128
23	xyclohexyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	418,5
24	xyclohexyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	461,5
25	xyclopentyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	447
26	xyclopentyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	404
27	xyclobutyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	390
28	xyclobutyl	3,4-diclophenyl	CH(CF ₃)	433
29	-C≡CSi(Me) ₃	3,4-diclophenyl	CH(CN)	431,4
30	-C≡CSi(Me) ₃	3,4-diclophenyl	CH(NHC(O)Me)	463,4
31	-C≡CH	3,4-diclophenyl	CH(CN)	359,3
32	-C≡CPh	3,4-diclophenyl	CH(CN)	435,4
33	-C≡CCl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	393,2
34	xyclobutyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	433,4
35	xyclopropyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	72-75
36	xyclopentyl	5-clo-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	101-103
37	xyclopentyl	4-clo-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	103-107
38	xyclopentyl	4-clo-2-pyridinyl	CH(CN)	370,4
39	xyclopentyl	5-bromo-2-pyridinyl	CH(CN)	414,3
40	xyclopentyl	3,4-diclophenyl	CH(CN)	403,4
41	xyclopentyl	3,4-diclophenyl	CH(CF ₃)	446,4
42	tetrahydro-3-furanyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	406,4
43	tetrahydro-2-furanyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	406,5

44	xyclopentyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	O	75-78
45	xyclobutyl	5-clo-2-pyridinyl	CH(CN)	356,0
46	xyclobutyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	390,4
47	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	5-metyl-2-pyridinyl	CH(CN)	338,4
48	xyclopentyl	5-metyl-2-pyridinyl	CH(CN)	350,4
49	-CH(CH ₃)(2-flophenyl)	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	458,2
50	-CH(CH ₃)(2-flophenyl)	5-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	501,1
51	-CH(CH ₃)(2-flophenyl)	5-(triflometyl)-2-pyridinyl	O	435,1
52	xyclopentyl	5-bromo-4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	482,3
53	isopropyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	378,4
54	isopropyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	421,4
55	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	392,4
56	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	435,4
57	-CH(CH ₃)(2,6-diflophenyl)	3-clo-4-flophenyl	CH(CN)	459,1
58	-CH(CH ₃)(2,6-diflophenyl)	3-clo-4-flophenyl	CH(CF ₃)	502,1
59	-CH(CH ₃)(2,6-diflophenyl)	3-clo-4-flophenyl	O	436,1
60	-CH(CH ₃)(2,6-diflophenyl)	3-clo-4-flophenyl	CH(NHC(O)Me)	491,2
62	-CH(CH ₃)(2-flophenyl)	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	501,2
63	-CH(CH ₃)(2-flophenyl)	5-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	458,1
64	xyclopentyl	2-pyridinyl	CH(CN)	336,4
65	xyclopentyl	5-bromo-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	457,3
66	xyclopentyl	5-clo-2-pyridinyl	CH(CN)	107-110
67	Metyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	350,4

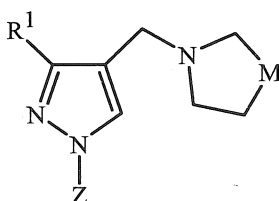
68	Metyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	393,4
69	1-xyclopentenyl	4-(triflometyl)-2-pyridinyl	CH(CN)	402,3
70	xyclopentyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	CH(CN)	388,4
71	xyclopentyl	4-clo-5-flo-2-pyridinyl	CH(CF ₃)	431,4

Bảng chỉ số B



<u>Hợp chất số</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>M</u>	<u>MS hoặc MP</u>
3	-CH ₂ (2-flophenyl)	3,4-điclophenyl	CH(CN)	443,1
6	-CH ₂ (2-flophenyl)	4-clophenyl	CH(NHC(O)Me)	441,1

Bảng chỉ số C



<u>Hợp chất số</u>	<u>R¹</u>	<u>Z</u>	<u>M</u>	<u>MS hoặc MP</u>
7	-CH ₂ (2-flophenyl)	4-clophenyl	CH(NHC(O)Me)	427,4
13	xyclopropyl	3,4-điclophenyl	(S)-CH(NHC(O)Me)	393,4
20	xyclohexyl	3,4-điclophenyl	CH(NHC(O)(xyclopropyl))	95–95
22	Metyl	3,4-điclophenyl	CH(NHC(O)(xyclopropyl))	88–92
61	-CH(CH ₃)(2,6-điflophenyl)	3-clo-4-flophenyl	(S)-CH(NHC(O)Me)	477,2

Các thử nghiệm sau chứng minh hiệu quả phòng trừ của hợp chất theo sáng chế đối với các loài gây hại cụ thể. “Hiệu quả phòng trừ” là việc ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (bao gồm tỷ lệ tử vong) mà làm giảm đáng kể việc tiếp nhận thức ăn. Tuy nhiên, việc bảo vệ bằng cách phòng trừ loài gây hại bằng hợp chất này không giới hạn ở các loài này. Xem Bảng chỉ số A–C trong phần mô tả hợp chất.

Ví dụ thử nghiệm sinh học

Chế phẩm và phương pháp phun trong các thử nghiệm A-F

Hợp chất thử nghiệm được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 10% axeton, 90% nước và 300ppm chất hoạt động bề mặt không ion X-77® Spreader Lo-Foam Formula chứa alkylarylpolyoxyetylen, axit béo tự do, glycol và isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Hợp chất đã điều chế được đưa vào 1mL chất lỏng nhờ vòi phun SUJ2 có phần thân 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) đặt ở vị trí cách 1,27 cm (0,5 inso) trên đỉnh của mỗi đơn vị thử nghiệm. Hợp chất thử nghiệm được phun ở tốc độ được chỉ định, và mỗi thử nghiệm được thực hiện ba lần.

Thử nghiệm A

Để đánh giá mức phòng trừ sâu tơ hại cải bắp (*Plutella xylostella* (L.)) đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong cây mù tạc 12–14 ngày tuổi. Cây này được cho gây nhiễm trước bằng ~50 ấu trùng chưa được 1 tháng mà được phân vào đơn vị thử nghiệm nhờ bột yến mạch trộn ngũ cốc bằng cách sử dụng dụng cụ cấy. Các ấu trùng này di chuyển lên cây thử nghiệm sau khi được phân vào đơn vị thử nghiệm.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã pha chế, mỗi đơn vị thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và sau đó nắp chắn màu đen được đặt lên trên. Đơn vị thử nghiệm này được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 25°C và độ ẩm tương đối 70%. Mức tổn hại do cây bị ăn sau đó được đánh giá bằng trực quan dựa trên cơ sở tán lá đã bị ăn, và ấu trùng được đánh giá về tỷ lệ tử vong.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, thu được mức hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời dưới đây (40% hoặc thấp hơn mức tổn hại do cây bị ăn và/hoặc 100% tỷ lệ tử vong): 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 35, 36, 37, 38, 46 và 66.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, thu được mức hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời dưới đây (40% hoặc thấp hơn mức tổn hại do cây bị ăn và/hoặc 100% tỷ lệ tử vong): 1, 2, 12, 13, 14, 15, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 31, 32, 35, 36, 37, 38, 46 và 66.

Thử nghiệm B

Để đánh giá mức phòng trừ sâu bướm (*Spodoptera frugiperda* (J.E. Smith)) đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong ngũ cốc (ngô) 4-5 ngày tuổi. Cây này được cho gây nhiễm trước bằng 10–15 ấu trùng 1 ngày tuổi vào một miếng thức ăn cho côn trùng.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã pha chế, đơn vị thử nghiệm này được duy trì trong buồng sinh trưởng trong 6 ngày ở 25°C và độ ẩm tương đối 70%. Mức tổn hại do cây bị ăn sau đó được đánh giá bằng trực quan dựa trên cơ sở tán lá đã bị ăn, và ấu trùng được đánh giá về tỷ lệ tử vong.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, thu được mức hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời dưới đây (40% hoặc thấp hơn mức tổn hại do cây bị ăn và/hoặc 100% tỷ lệ tử vong): 9, 19, 20, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 35, 36, 37, 38, 46 và 66.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, thu được mức hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời dưới đây (40% hoặc thấp hơn mức tổn hại do cây bị ăn và/hoặc 100% tỷ lệ tử vong): 9, 19, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 35, 36, 37, 38, 46 và 66.

Thử nghiệm C

Để đánh giá mức phòng trừ rầy ngũ cốc (*Peregrinus maidis* (Ashmead)) nhờ tiếp xúc hoặc các phương tiện hệ thống, đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong ngũ cốc (ngô) 3–4 ngày tuổi. Cát trắng được bổ sung vào phần trên của đất trồng trước khi phun hợp chất thử nghiệm.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã pha chế, đơn vị thử nghiệm này được làm khô trong 1 giờ trước khi chúng được gây nhiễm sau bằng ~15–20 thiếu trùng (18 đến 21 ngày tuổi). Nắp chắn màu đen được đặt lên trên mỗi đơn vị thử nghiệm, và đơn vị thử nghiệm này được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 22–24°C và độ ẩm tương đối 50–70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá bằng trực quan về tỷ lệ tử vong của sâu bọ.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 25, 34, 54 và 56.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 54.

Thử nghiệm D

Để đánh giá mức phòng trừ rầy xanh đuôi đen khoai tây (*Empoasca fabae* (Harris)) nhờ tiếp xúc hoặc các phương tiện hệ thống, đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong cây đậu Soleil 5-6 ngày tuổi (primary leaves emerged). Cát trắng được bổ sung vào phần trên của đất trồng, và một trong những lá ban đầu được cắt ra trước khi phun hợp chất thử nghiệm.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã pha chế, đơn vị thử nghiệm này được làm khô trong 1 giờ trước khi chúng được gây nhiễm sau bằng 5 rầy xanh đuôi đen khoai tây (18 đến 21 ngày tuổi người lớn). Nắp chắn màu đen được đặt lên trên đơn vị thử nghiệm, và đơn vị thử nghiệm này được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 20°C và độ ẩm tương đối 70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá bằng trực quan về tỷ lệ tử vong của sâu bọ.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 9, 10, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 38, 41, 42, 46, 49, 53, 54, 56 và 62.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 24, 25, 54 và 56.

Thử nghiệm E

Để đánh giá mức phòng trừ rệp đào xanh (*Myzus persicae* (Sulzer)) nhờ tiếp xúc hoặc các phương tiện hệ thống, đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong cây củ cải 12–15 ngày tuổi. Cây này được gây nhiễm trước bằng cách đặt lên lá của cây thử nghiệm 30–40 con rệp trên phần lá được cắt ra từ cây nuôi trồng (phương pháp cắt lá). Rệp cây này di chuyển lên cây thử nghiệm vì phần lá được sấy khô. Sau khi gây nhiễm trước, đất của đơn vị thử nghiệm được phủ một lớp cát.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã pha chế, mỗi đơn vị thử nghiệm được để khô trong 1 giờ và sau đó nắp chắn màu đen được đặt lên trên. Đơn vị thử nghiệm này được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 19–21°C và độ ẩm tương đối 50–70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá bằng trực quan về tỷ lệ tử vong của sâu bọ.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 1, 9, 14, 17, 25, 26, 27, 28 và 34.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, kết quả thu được là ít nhất 80% tỷ lệ tử vong: 1 và 26.

Thử nghiệm F

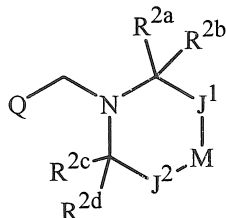
Để đánh giá mức phòng trừ bọ trĩ hoa (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) nhờ tiếp xúc hoặc các phương tiện hệ thống, đơn vị thử nghiệm bao gồm một đồ chứa có khe nhỏ chứa bên trong cây đậu Soleil 5–7 ngày tuổi.

Hợp chất thử nghiệm được pha chế và phun ở nồng độ 250ppm. Sau khi phun, đơn vị thử nghiệm này được làm khô trong 1 giờ, và sau đó 22–27 bọ trĩ trưởng thành được cho vào mỗi đơn vị thử nghiệm. Nắp chắn màu đen được đặt lên trên, và đơn vị thử nghiệm này được giữ trong 6 ngày ở 25°C và 45–55% tương đối độ ẩm.

Hợp chất có công thức 1 được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, thu được mức hiệu quả phòng trừ từ rất tốt đến tuyệt vời dưới đây (30% hoặc thấp hơn mức tổn hại thực vật và/hoặc 100% tỷ lệ tử vong): 25, 26 và 27.

Yêu cầu bảo hộ

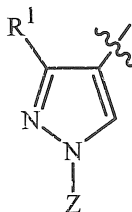
1. Hợp chất được chọn từ hợp chất có Công thức 1, N-oxit hoặc muối của nó:



1

trong đó:

Q là



Q-1 ;

R^1 là C_3 – C_6 xycloalkyl hoặc vòng bão hòa có 3 đến 6 cạnh chứa một nguyên tử oxy là một thành viên vòng và các nguyên tử cacbon là các thành viên vòng còn lại;

Z là phenyl hoặc vòng dị thơm có 6 cạnh, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 3 R^4 ;

R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} và R^{2d} là H;

mỗi R^4 độc lập là halogen, C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl;

J^1 là CH_2 ;

J^2 là liên kết trực tiếp hoặc CH_2 ;

M là $-CH(A)-$;

A là xyano, C_1 – C_4 haloalkyl, $NHC(O)R^{5a}$ hoặc 1,3,4-oxadiazol-2-yl; và

mỗi R^{5a} độc lập là C_1 – C_4 alkyl hoặc C_1 – C_4 haloalkyl.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó:

Z là phenyl hoặc pyridinyl, mỗi nhóm này được thế bằng 1 đến 2 R⁴; và
M là –CH(CN)– or –CH(CF₃)–.

3. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này được chọn từ nhóm bao gồm:

2-[3-xyclohexyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin;

2-[3-xyclopentyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin;

1-[[3-xyclopentyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(5-bromo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[3-xyclopentyl-1-(3,4-diclophenyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[3-(tetrahydro-2-furanyl)-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[3-xyclobutyl-1-[4-(triflometyl)-2-pyridinyl]-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[3-xyclopentyl-1-(5-metyl-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

5-bromo-2-[3-xyclopentyl-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin;

1-[[1-(5-clo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-5-flo-2-pyridinyl)-3-xyclopentyl-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-5-flo-2-pyridinyl)-3-(tetrahydro-2-furanyl)-1*H*-pyrazol-4-yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

1-[[1-(4-clo-2-pyridinyl)-3-(tetrahydro-2-furanyl)-1*H*-pyrazol-4-

yl]metyl]-4-piperidincarbonitril;

2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]-4-(triflometyl)pyridin;

4-clo-5-flo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin;

4-clo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin;

5-metyl-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin; và

5-clo-2-[3-(tetrahydro-2-furanyl)-4-[[4-(triflometyl)-1-piperidinyl]metyl]-1*H*-pyrazol-1-yl]pyridin.

4. Chế phẩm chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung.

5. Chế phẩm theo điểm 4, trong đó ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axetamiprit, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadiractin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, clorfenapyr, clopyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamit, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinat, formetanat, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprit, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, metomyl, metoprene,

metoxyfenozit, metofluthrin, monoflothrín, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodín, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumezopyrim, triflumuron, nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*, tất cả các chủng *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng virus nhiều mặt nhân.

6. Chế phẩm bảo vệ động vật tránh khỏi loài gây hại không xương sống ký sinh chứa lượng hữu hiệu có tác dụng diệt ký sinh trùng của hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 và ít nhất một chất mang.

7. Phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống này hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu về mặt sinh học của hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp điều trị bệnh cho người hoặc động vật bằng liệu pháp điều trị.

8. Hạt đã được xử lý chứa hợp chất theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% khối lượng hạt trước khi xử lý.