



(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)



1-0039483

(51)⁸ C07D 401/04; C07D 401/14; A01N
43/56; A01N 43/60

(13) B

(21) 1-2017-03473

(22) 03/03/2016

(86) PCT/US2016/020612 03/03/2016

(87) WO2016/144678 15/09/2016

(30) 62/131,949 12/03/2015 US

(45) 25/04/2024 433

(43) 25/12/2017 357A

(73) FMC CORPORATION (US)

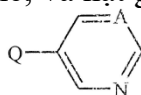
2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America

(72) ZHANG, Wenming (CN); ROSSI, Michael Alan (US); SANA, Kasinath (IN).

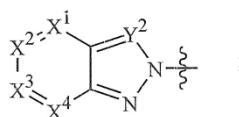
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT TRỪ DỊCH HẠI AZOL HAI VÒNG ĐƯỢC THỂ DỊ VÒNG, CHẾ PHẨM TRỪ DỊCH HẠI CHỨA HỢP CHẤT NÀY, PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT DỊCH HẠI KHÔNG XƯƠNG SỐNG VÀ HẠT GIỐNG ĐƯỢC XỬ LÝ

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (1), bao gồm toàn bộ các chất đồng phân lập thể và đồng phân hình học, *N*-oxit, và muối của nó, trong đó Q là Q-2 và A, R¹, m, X¹, X², X³, X⁴, Y¹, Y² và Y³ được định nghĩa như trong bản mô tả; chế phẩm trừ dịch hại chứa hợp chất này; phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế; và hạt giống được xử lý.



1



Q-2

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

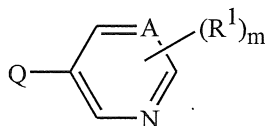
Sáng chế đề cập đến hợp chất trừ dịch hại azol hai vòng được thế, *N*-oxit, muối của nó, chế phẩm trừ dịch hại chứa hợp chất này, và phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống bằng hợp chất này, như động vật chân đốt, thích hợp để sử dụng trong cả môi trường nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Dịch hại không xương sống rất cần được kiểm soát để đạt được năng suất cây trồng cao. Tổn thương gây ra bởi dịch hại không xương sống đối với cây trồng đang sinh trưởng và cây trồng nông nghiệp được bảo quản có thể làm giảm đáng kể năng suất, do đó làm tăng chi phí đối với người tiêu dùng. Dịch hại không xương sống cũng cần được kiểm soát ở rừng, cây trồng trong nhà kính, cây cảnh, vườn ươm, thực phẩm được bảo quản và sản phẩm sợi, vật nuôi, hộ gia đình, bãi cỏ, sản phẩm gỗ, và sức khỏe động vật và cộng đồng. Dịch hại không xương sống đã được kiểm soát bằng nhiều chế phẩm có bán trên thị trường, tuy nhiên vẫn cần có hợp chất thế hệ mới hiệu quả hơn, chi phí thấp, ít độc, an toàn hơn với môi trường hoặc có cơ chế tác dụng khác.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

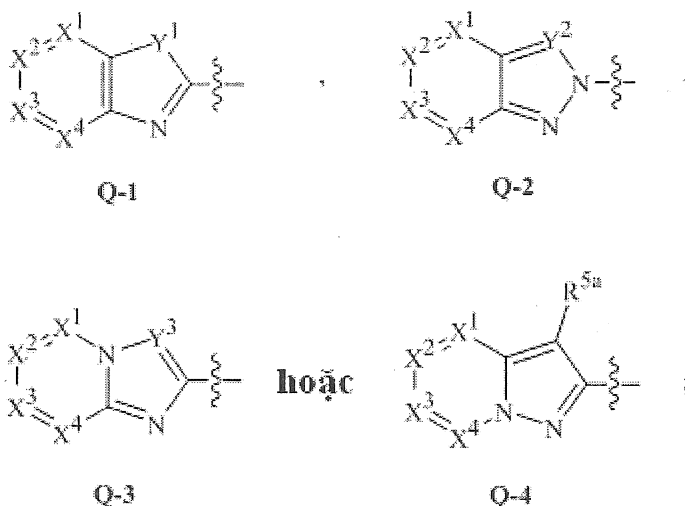
Sáng chế đề cập đến hợp chất có công thức (1) (bao gồm toàn bộ các chất đồng phân lập thể và đồng phân hình học), *N*-oxit, và muối của nó, chế phẩm trừ dịch hại chứa hợp chất này và phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống:



1

trong đó

Q là



A là CH, CR¹ hoặc N;

mỗi R¹ độc lập là halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio hoặc C₁-C₄ haloalkylthio;

m bằng 0, 1, 2 hoặc 3;

X¹, X², X³ và X⁴ độc lập với nhau là CR², CR³ hoặc N, với điều kiện là (i) một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là CR², và (ii) không nhiều hơn một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là N;

R² là C(=Z)R¹¹, N(R⁸)C(=NR⁸)R⁹ hoặc LQ^a; hoặc C₁-C₆ alkoxy tùy ý được thế bằng C(=Z)R¹¹, C(=Z)NR⁶R⁷ hoặc tối đa 3 R^y; hoặc C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl hoặc C₂-C₄ alkynyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng C(=Z)R¹¹ hoặc C(=Z)NR⁶R⁷, và mỗi nhóm này tùy ý còn được thế tối đa bằng 3 R^y;

L là O, S(O)_n, NR⁸ hoặc C(=Z);

mỗi Z độc lập là O hoặc S;

mỗi R³ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy hoặc C₁-C₄ haloalkoxy;

Y¹ là O, S hoặc NR⁴;

Y² là N hoặc CR^{5a};

Y³ là N hoặc CR^{5b};

R⁴ là H hoặc C₁-C₄ alkyl;

R^{5a} là H, halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^{5b} là H, halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^6 là H, $NR^{15}R^{16}$, OR^{17} , $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một R^x ;

R^7 là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một R^x ; hoặc

R^6 và R^7 cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thể hoặc được thể tối đa bằng 4 R^x ; hoặc

R^6 và R^7 cùng với nhau là $=S(O)_pR^{18}R^{19}$ hoặc $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_3 - C_6 xycloalkoxy, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $OC(O)R^{22}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$, $Si(R^{28})_3$, $OSi(R^{28})_3$ hoặc Q^b ;

mỗi R^y độc lập là halogen, xyano, hydroxy, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_3 - C_6 xycloalkoxy, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $OC(O)R^{22}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ;

R^8 là H, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một R^x ;

R^9 là H, $C(=NR^{10})R^{11}$, OR^{21} hoặc $NR^{15}R^{16}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một R^x ; hoặc phenyl, phenoxy hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một phần tử thể độc lập được chọn từ nhóm

bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử 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 1 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁰ độc lập là OR¹², S(O)_nR¹³ hoặc NHR¹⁴;

mỗi R¹¹ độc lập là H; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy hoặc C₃-C₆ xycloalkoxy, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²² hoặc Q^b;

mỗi R¹² độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²², S(O)_nR¹³ hoặc Q^b;

mỗi R¹³ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl;

R¹⁴ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²² hoặc C(O)OR²¹; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

R¹⁵ là H, NR^{15a}R^{16a}, OR¹⁷, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR^{15a}R^{16a}, C(O)R²², S(O)_nR²³ hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R¹⁶ là H hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc

R¹⁵ và R¹⁶ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và

C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 R^x; hoặc

R¹⁵ và R¹⁶ cùng với nhau là =S(O)_pR¹⁸R¹⁹ hoặc =S(=NR²⁰)R¹⁸R¹⁹;

mỗi R^{15a} độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²⁷ hoặc S(O)₂R²⁷; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R^{16a} độc lập là H, C₁-C₆ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc

R^{15a} và R^{16a} cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

R¹⁷ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁸ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁹ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R¹⁸ và R¹⁹ cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào tạo thành vòng;

R^{20} là H, xyano, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc $C(O)R^{22}$; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{21} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{22} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_6 haloxycloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_3 - C_6 xycloalkoxy hoặc $NR^{25}R^{26}$; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_6 haloxycloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkylalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkylalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1 - C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} độc lập cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²⁷ độc lập là C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy hoặc NR²⁹R³⁰; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²⁸ độc lập là C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R²⁹ độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R³⁰ độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R²⁹ và R³⁰ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

Q^a là vòng hoặc hệ vòng thơm có 5 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử độc lập được chọn từ một nguyên tử oxy, một nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S)

và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc vòng no một phần có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm trừ dịch hại, chứa hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, 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 kiểm soát dịch hại không xương sống, chứa hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, 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, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế). Sáng chế cũng đề xuất phương pháp kiểm soát dịch hại

không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của chế phẩm trừ dịch hại, chứa lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, 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, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa lượng hữu hiệu của ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho hạt giống này tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế). Sáng chế cũng đề cập đến hạt giống được xử lý. Sáng chế cũng mô tả phương pháp bảo vệ động vật khỏi dịch hại ký sinh không xương sống, bao gồm bước cho động vật này tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế). Sáng chế cũng mô tả việc sử dụng hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế) để bảo vệ động vật khỏi dịch hại không xương sống.

Sáng chế cũng đề xuất phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng này, hạt giống từ đó cây trồng này được sinh trưởng hoặc môi trường sinh sống (ví dụ môi trường sinh trưởng) của cây trồng này tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1) (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế).

Mô tả chi tiết sáng chế

Thuật ngữ “bao gồm”, “có”, “chứa”, “khác biệt ở chỗ” hoặc các biến thể khác của chúng được dùng trong bản mô tả để chỉ sự bao gồm không giới hạn, tùy thuộc vào bất kỳ giới hạn nào được nêu rõ. Ví dụ, chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp bao gồm danh sách các yếu tố không nhất thiết phải giới hạn ở chỉ các yếu tố này nhưng có thể bao gồm các yếu tố khác không được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có của chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp này.

Thuật ngữ “cấu thành từ” không bao gồm yếu tố, bước, hoặc thành phần bất kỳ không được xác định. Khi trong bộ yêu cầu bảo hộ, như vậy sẽ giới hạn yêu cầu bảo hộ cho việc đưa vào các tài liệu khác với các tài liệu đã được đọc, ngoại trừ các yếu tố không rõ ràng liên quan. Khi thuật ngữ “cấu thành từ” xuất hiện trong mệnh đề của phần thân

yêu cầu bảo hộ, chứ không phải ngay lời mở đầu của nó, nó chỉ giới hạn các yếu tố quy định trong mệnh đề đó; các yếu tố khác không bị loại trừ khỏi toàn bộ yêu cầu bảo hộ.

Thuật ngữ “cấu thành chủ yếu từ” được sử dụng trong bản mô tả để chỉ chế phẩm hoặc phương pháp bao gồm các nguyên liệu, bước, dấu hiệu, thành phần, hoặc yếu tố, ngoài các nguyên liệu, bước, dấu hiệu, thành phần, hoặc yếu tố đã được bộc lộ cụ thể, với điều kiện là các nguyên liệu, bước, dấu hiệu, thành phần, hoặc yếu tố bổ sung này không ảnh hưởng đến các đặc tính mới và cơ bản của sáng chế. Thuật ngữ “cấu thành chủ yếu từ” bao gồm cả “chứa” và “cấu thành từ”.

Khi các tác giả sáng chế đã xác định sáng chế hoặc một phần sáng chế với thuật ngữ không hạn chế, như “chứa”, cần hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả cần được diễn giải để mô tả sáng chế bằng cách sử dụng thuật ngữ “cấu thành chủ yếu từ” hoặc “cấu thành từ”.

Hơn nữa, trừ khi có quy định khác, “hoặc” được dùng trong bản mô tả để chỉ bao gồm hoặc không bao gồm. Ví dụ, điều kiện A hoặc B thỏa mãn mệnh đề bất kỳ sau: A là đúng (hoặc có mặt) và B là sai (hoặc không có mặt), A là sai (hoặc không có mặt) và B là đúng (hoặc có mặt), và cả A lẫn B đều đúng (hoặc có mặt).

Ngoài ra, các mạo từ không xác định “a” và “an” đứng trước yếu tố hoặc thành phần theo sáng chế được dự định là không giới hạn về số lượng các trường hợp (tức là tần suất xuất hiện) của yếu tố hoặc thành phần này. Do đó “a” hoặc “an” sẽ bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng số ít của yếu tố hoặc thành phần này cũng bao gồm dạng số nhiều trừ khi số lượng được quy định là số ít.

Thuật ngữ “dịch hại không xương sống” được dùng trong bản mô tả để chỉ dịch hại, như động vật chân đốt, động vật chân bụng, giun tròn và giun sán. Thuật ngữ “động vật chân đốt” bao gồm côn trùng, bét, nhện, bọ cạp, rết, động vật nhiều chân, sâu đá và bọ rết. Thuật ngữ “động vật chân bụng” bao gồm ốc sên, sên và các loài *Stylommatophora* khác. Thuật ngữ “giun tròn” bao gồm các loài thuộc ngành *Nematoda*, như giun tròn ăn thực vật và giun sán giun tròn ký sinh động vật. Thuật ngữ “giun sán” bao gồm toàn bộ các giun ký sinh, như giun tròn (ngành *Nematoda*), giun chỉ (ngành *Nematoda*, lớp *Secernentea*), sán lá (ngành *Platyhelminthes*, lớp *Tematoda*), sâu bọ đầu gai (ngành *Acanthocephala*), và sán xơ mít (ngành *Platyhelminthes*, lớp *Cestoda*).

Thuật ngữ “kiểm soát dịch hại không xương sống” được dùng trong bản mô tả để chỉ biện pháp ức chế phát triển của dịch hại không xương sống (bao gồm gây chết, giảm đặc tính ăn, và/hoặc rối loạn sinh sản), và các thuật ngữ liên quan được định nghĩa tương tự.

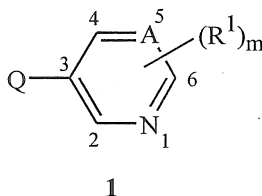
Thuật ngữ “nông nghiệp” được dùng trong bản mô tả để chỉ quá trình sản xuất cây trồng trên cánh đồng, như cây trồng dùng làm thực phẩm và cho sợi và bao gồm quá trình sinh trưởng của bắp hoặc ngô, đậu tương và các cây họ đậu khác, lúa, cây ngũ cốc (ví dụ lúa mỳ, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và lúa), rau xanh cho lá (ví dụ rau diếp, cải bắp, và các cây lương thực khác), rau xanh cho quả (ví dụ cà chua, tiêu, cà tím, cây họ cải và bầu bí), khoai tây, khoai lang, nho, bông, cây ăn quả (ví dụ táo, mơ và cây họ cam), cây ăn quả loại nhỏ (ví dụ cây trứng cá và anh đào) và các cây trồng có giá trị khác (ví dụ cải dầu, hướng dương và ô liu).

Thuật ngữ “phi nông nghiệp” được dùng trong bản mô tả để chỉ các lĩnh vực không phải là lĩnh vực trồng trọt, như làm vườn (ví dụ thực vật trong nhà kính, vườn ươm hoặc cây cảnh không sinh trưởng trên cánh đồng), nhà ở, công trình nông nghiệp, công trình thương mại và công trình công nghiệp, bãi cỏ (ví dụ nông trại, đồng cỏ, sân gôn, sân cỏ, sân thể thao, v.v), sản phẩm gỗ, sản phẩm được bảo quản, quản lý nông lâm nghiệp và thực vật, sức khỏe cộng đồng (tức là người) và sức khỏe động vật (ví dụ động vật được thuần hóa, như thú cưng, vật nuôi và gia cầm, động vật chưa được thuần hóa, như động vật tự nhiên).

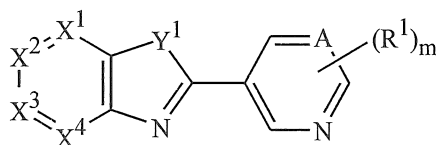
Thuật ngữ “sức khỏe cây trồng” được dùng trong bản mô tả để chỉ tốc độ sinh trưởng hoặc tích tụ sinh khối của cây trồng. Thuật ngữ “tăng sức khỏe cây trồng” được dùng trong bản mô tả để chỉ biện pháp tăng sinh trưởng hoặc tích tụ sinh khối trong cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý. Thuật ngữ “năng suất cây trồng” được dùng trong bản mô tả để chỉ số lượng và chất lượng cây trồng, thu được sau khi thu hoạch cây trồng. Thuật ngữ “tăng năng suất cây trồng” được dùng trong bản mô tả để chỉ biện pháp tăng năng suất cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý.

Thuật ngữ “lượng hữu hiệu” được dùng trong bản mô tả để chỉ lượng hợp chất có hoạt tính sinh học (ví dụ hợp chất có công thức (1)) đủ để tạo ra tác dụng sinh học mong muốn khi bón vào (tức là tiếp xúc với) dịch hại không xương sống cần kiểm soát hoặc môi trường của nó, hoặc thực vật, hạt giống từ đó thực vật này được sinh trưởng, hoặc

môi trường sinh sống của thực vật (ví dụ môi trường sinh trưởng) để bảo vệ thực vật khỏi bị tổn thương bởi dịch hại không xương sống hoặc tác dụng mong muốn khác (ví dụ tăng sức khỏe thực vật). Vị trí của nhóm thế R^1 trong hợp chất có công thức (1) được mô tả bằng hệ thống đánh số thứ tự được thể hiện dưới đây.



Đường lượn sóng trong gốc có công thức cấu tạo cụ thể thể hiện vị trí gắn của gốc này vào phần còn lại của phân tử. Ví dụ, khi nhóm thế Q trong hợp chất có công thức (1) được xác định là Q-1, thì đường lượn sóng phân cắt liên kết trong Q-1 có nghĩa là Q-1 được gắn vào phần còn lại của cấu trúc có công thức (1) ở vị trí này, như được thể hiện dưới đây.



Trong công thức cấu tạo Q-1, Q-2, Q-3 và Q-4, các nhóm thế X^1 , X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^2 , CR^3 hoặc N, với điều kiện là (i) một trong số các nhóm X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là CR^2 , và (ii) không nhiều hơn một trong số các nhóm X^1 , X^2 , X^3 và X^4 là N. Định nghĩa này của X^1 , X^2 , X^3 và X^4 mô tả 16 tổ hợp có thể của X^1 , X^2 , X^3 và X^4 , được thể hiện trong Bảng dưới đây.

Tổ hợp	X^1	X^2	X^3	X^4
1	CR^2	CR^3	CR^3	CR^3
2	CR^2	N	CR^3	CR^3
3	CR^2	CR^3	N	CR^3
4	CR^2	CR^3	CR^3	N
5	CR^3	CR^2	CR^3	CR^3
6	N	CR^2	CR^3	CR^3
7	CR^3	CR^2	N	CR^3
8	CR^3	CR^2	CR^3	N
9	CR^3	CR^3	CR^2	CR^3
10	N	CR^3	CR^2	CR^3
11	CR^3	N	CR^2	CR^3
12	CR^3	CR^3	CR^2	N
13	CR^3	CR^3	CR^3	CR^2
14	N	CR^3	CR^3	CR^2
15	CR^3	N	CR^3	CR^2
16	CR^3	CR^3	N	CR^2

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

Thuật ngữ “alkoxy” bao gồm, ví dụ metoxy, etoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy và butoxy khác, pentoxy và đồng phân hexyloxy. Thuật ngữ “alkylthio” bao gồm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh, như metylthio, etylthio, và propylthio khác, butylthio, pentylthio và đồng phân hexylthio.

Thuật ngữ “xycloalkyl” bao gồm, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl.

Thuật ngữ “halogen” được sử dụng riêng hoặc trong các thuật ngữ mô tả hợp chất, như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong mô tả, như “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Hơn nữa, khi được sử dụng trong các thuật ngữ mô tả hợp chất, như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong mô tả, như “alkyl được thế bằng halogen”, alkyl này có thể được thế một phần hoặc toàn bộ bằng các nguyên tử halogen có thể giống hoặc khác nhau. Ví dụ về “haloalkyl” hoặc “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm F_3C- , $ClCH_2-$, CF_3CH_2- và CF_3CCl_2- . Thuật ngữ “haloxycloalkyl”, “haloalkoxy”, “haloalkylthio”, “haloalkenyl”, “haloalkynyl”, và tương tự, được định nghĩa tương tự như thuật ngữ “haloalkyl”. Ví dụ về “haloalkoxy” bao gồm CF_3O- , CCl_3CH_2O- , $HCF_2CH_2CH_2O-$ và CF_3CH_2O- . Ví dụ về “haloalkylthio” bao gồm CCl_3S- , CF_3S- , CCl_3CH_2S- và $ClCH_2CH_2CH_2S-$. Các ký hiệu viết tắt $S(O)$ và $S(=O)$ được dùng trong bản mô tả để chỉ gốc sulfinyl. Các ký hiệu viết tắt SO_2 , $S(O)_2$ và $S(=O)_2$ được dùng trong bản mô tả để chỉ gốc sulfonyl. Các ký hiệu viết tắt $C(O)$ và $C(=O)$ được dùng trong bản mô tả để chỉ gốc carbonyl. Các ký hiệu viết tắt CO_2 , $C(O)O$ và $C(=O)O$ được dùng trong bản mô tả để chỉ gốc oxycarbonyl. “CHO” là formyl.

Tổng số lượng nguyên tử cacbon trong nhóm thế được thể hiện bằng tiền tố “C_i-C_j” trong đó i và j nằm trong khoảng từ 1 đến 6. Ví dụ, C₁-C₄ alkylsulfonyl thể hiện metylsulfonyl đến butylsulfonyl; C₂ alkoxyalkyl thể hiện CH₃OCH₂-; C₃ alkoxyalkyl thể hiện, ví dụ CH₃CH(OCH₃)-, CH₃OCH₂CH₂- hoặc CH₃CH₂OCH₂-; và C₄ alkoxyalkyl thể hiện các đồng phân khác nhau của nhóm alkyl được thế bằng nhóm alkoxy chứa tổng cộng bốn nguyên tử cacbon, ví dụ bao gồm CH₃CH₂CH₂OCH₂- và CH₃CH₂OCH₂CH₂-.

Khi hợp chất được thế bằng phần tử thế mang chỉ số dưới thể hiện số lượng của các phần tử thế này có thể vượt quá 1, các phần tử thế này (khi chúng vượt quá 1) độc lập được chọn từ nhóm bao gồm các phần tử thế được xác định, ví dụ (R¹)_m, m bằng 0, 1, 2 hoặc 3. Hơn nữa, khi chỉ số dưới thể hiện khoảng, ví dụ (R)_{i-j}, thì số lượng của các phần tử thế có thể được chọn từ các số nguyên nằm trong khoảng từ i đến j. Khi nhóm chứa phần tử thế có thể là hydro, ví dụ R³ hoặc R⁴, khi phần tử thế này là hydro, thì có nghĩa là nhóm này không được thế. Khi nhóm thế tùy ý được gắn vào vị trí, ví dụ (R¹)_m, trong đó m có thể bằng 0, thì hydro có thể ở vị trí ngay cả khi không được thể hiện trong định nghĩa nhóm thế. Khi một hoặc nhiều vị trí trên nhóm “không được thế” hoặc “chưa được thế”, thì các nguyên tử hydro được gắn vào để thu được hóa trị tự do bất kỳ.

Trừ khi có quy định khác, “vòng” hoặc “hệ vòng” là thành phần của hợp chất có công thức (1) (ví dụ phần tử thế Q^a) là vòng cacbon hoặc dị vòng. Thuật ngữ “hệ vòng” thể hiện hai hoặc nhiều vòng được dung hợp. Thuật ngữ “hệ vòng hai vòng” và “hệ vòng hai vòng được dung hợp” thể hiện hệ vòng cấu thành từ hai vòng được dung hợp, có thể “được dung hợp ortho”, “hai vòng được tạo cầu” hoặc “hai vòng xoắn”. Thuật ngữ “hệ vòng hai vòng được dung hợp ortho” thể hiện hệ vòng, trong đó hai vòng cấu thành có hai nguyên tử liên kề. Thuật ngữ “hệ vòng hai vòng được tạo cầu” được tạo thành bằng cách liên kết gốc chứa một hoặc nhiều nguyên tử với đỉnh không liên kề của vòng. Thuật ngữ “hệ vòng hai vòng xoắn” được tạo thành bằng cách liên kết gốc chứa hai hoặc nhiều nguyên tử với cùng đỉnh của vòng. Thuật ngữ “hệ vòng hai dị vòng được dung hợp” thể hiện hệ vòng hai vòng được dung hợp trong đó ít nhất một nguyên tử trên vòng không phải là cacbon. Thuật ngữ “đỉnh vòng” được dùng trong bản mô tả để chỉ nguyên tử hoặc gốc khác (ví dụ C(=O), C(=S), S(O) hoặc S(O)₂) tạo thành khung của vòng hoặc hệ vòng.

Thuật ngữ “vòng cacbon”, “mạch vòng cacbon” hoặc “hệ vòng cacbon” thể hiện vòng hoặc hệ vòng, trong đó các nguyên tử tạo thành khung vòng chỉ được chọn từ cacbon. Thuật ngữ “vòng dị vòng”, “dị vòng” hoặc “hệ dị vòng” thể hiện vòng hoặc hệ

vòng trong đó ít nhất một nguyên tử tạo thành khung vòng không phải là cacbon, ví dụ nitơ, oxy hoặc lưu huỳnh. Thông thường vòng dị vòng chứa không nhiều hơn 4 nitơ, không nhiều hơn 2 oxy và không nhiều hơn 2 lưu huỳnh. Trừ khi có quy định khác, vòng cacbon hoặc dị vòng có thể là vòng no hoặc vòng không no. Thuật ngữ “no” được dùng trong bản mô tả để chỉ vòng có khung cấu thành từ các nguyên tử được liên kết với nhau bằng liên kết đơn; trừ khi có quy định khác, các hóa trị nguyên tử còn lại được thể hiện bằng các nguyên tử hydro. Trừ khi có quy định khác, “vòng không no” có thể là vòng không no một phần hoặc không no hoàn toàn. Thuật ngữ “vòng không no hoàn toàn” là vòng chứa các nguyên tử trong đó các liên kết giữa các nguyên tử trên vòng là liên kết đôi hoặc liên kết đơn theo thuyết liên kết hóa trị và hơn nữa các liên kết giữa các nguyên tử trên vòng bao gồm càng nhiều liên kết đôi mà không phải là liên kết đôi tích lũy (tức là không chứa $C=C=C$ hoặc $C=C=N$). Thuật ngữ “vòng không no một phần” thể hiện vòng chứa ít nhất một đỉnh vòng được liên kết với đỉnh vòng liền kề thông qua liên kết đôi và số lượng liên kết đôi không tích lũy giữa các đỉnh vòng liền kề (tức là ở dạng đối xứng không no hoàn toàn của nó) có thể lớn hơn số lượng liên kết đôi có mặt (tức là ở dạng không no một phần của nó).

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

Thuật ngữ “thơm” có nghĩa là mỗi nguyên tử trên vòng đều nằm trên cùng một mặt phẳng và có p -orbital vuông góc với mặt phẳng vòng, và trong đó $(4n + 2) \pi$ electron, trong đó n là số nguyên dương, được liên kết với vòng để thỏa mãn quy tắc Hückel. Thuật ngữ “hệ vòng thơm” thể hiện vòng cacbon hoặc hệ dị vòng trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là vòng thơm. Khi vòng cacbon không no hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này cũng được gọi là “vòng thơm” hoặc “vòng cacbon thơm”.

Thuật ngữ “hệ vòng cacbon thơm” thể hiện hệ vòng cacbon trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là vòng thơm. Khi dị vòng không no hoàn toàn thỏa mãn quy tắc Hückel, thì vòng này cũng được gọi là “dị vòng thơm”, “hệ dị vòng thơm” hoặc “dị vòng vòng thơm”. Thuật ngữ “hệ dị vòng thơm” thể hiện hệ dị vòng trong đó ít nhất một vòng của hệ vòng này là vòng thơm. Thuật ngữ “hệ vòng không thơm” thể hiện vòng cacbon hoặc hệ dị vòng có thể no hoàn toàn, cũng như không no một phần hoặc hoàn toàn, với điều kiện là không vòng nào trong hệ vòng này là vòng thơm. Thuật ngữ “hệ vòng cacbon không thơm” thể hiện vòng cacbon trong đó không vòng nào trong hệ vòng này là

vòng thơm. Thuật ngữ “hệ dị vòng không thơm” thể hiện hệ dị vòng trong đó không vòng nào trong hệ vòng này là vòng thơm.

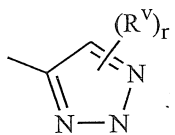
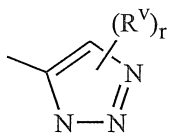
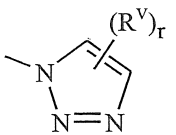
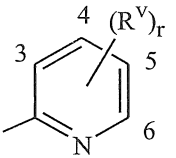
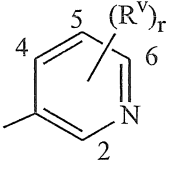
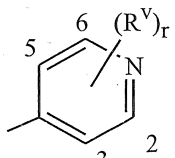
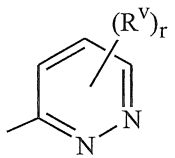
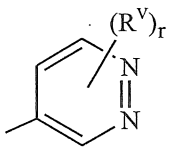
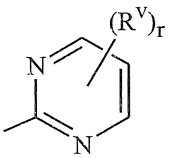
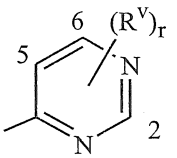
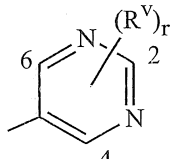
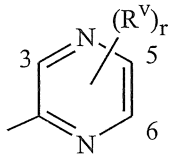
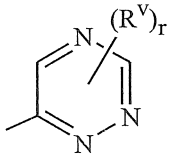
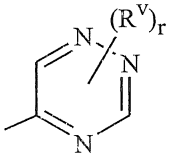
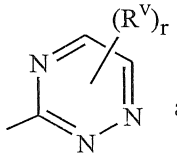
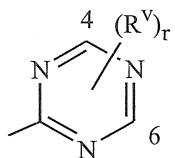
Thuật ngữ “tùy ý được thế” liên quan đến dị vòng được dùng trong bản mô tả đề chỉ các nhóm không được thế hoặc có ít nhất một phần tử thế không phải là hydro không làm mất hoạt tính sinh học tạo ra bởi bởi chất tương tự không được thế. Các phần định nghĩa sau cần áp dụng trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “tùy ý được thế” được sử dụng thay thế cho thuật ngữ “được thế hoặc không được thế” hoặc “(chưa) được thế”. Trừ khi có quy định khác, nhóm tùy ý được thế có thể có phần tử thế ở mỗi vị trí có thể được thế của nhóm này, và mỗi vị trí thế độc lập với nhau.

Khi phần tử thế là dị vòng chứa nitơ có 5 hoặc 6 cạnh, nó có thể được gắn vào phần còn lại có công thức (1) thông qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bất kỳ trên vòng, trừ khi có quy định khác. Như nêu trên, Q^a có thể là (trong số các nhóm khác) phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều các phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm các phần tử thế như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về phenyl tùy ý được thế bằng một đến năm phần tử thế là vòng U-1 trong bảng cấu trúc 1, trong đó R^v là R^x như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^a và r là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 5.

Như nêu trên, Q^b có thể là (trong số các nhóm khác) dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều các phần tử thế được chọn từ nhóm bao gồm các phần tử thế như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về hệ dị vòng thơm không nó có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều các phần tử thế bao gồm các vòng U-2 đến U-61 được thể hiện trong bảng cấu trúc 1, trong đó R^v là phần tử thế bất kỳ như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^b và r là số nguyên nằm trong khoảng từ 4, được giới hạn bởi số lượng các vị trí có sẵn trên mỗi nhóm U. Do vòng 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 có sẵn, đối với các nhóm U này, r chỉ bằng 0 hoặc 1 và r bằng 0 có nghĩa là nhóm U này không được thế và hydro có mặt ở vị trí được thể hiện bởi $(R^v)_r$.

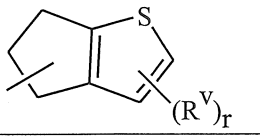
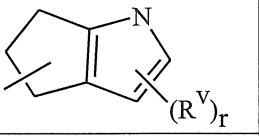
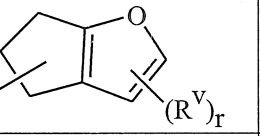
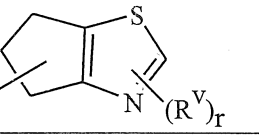
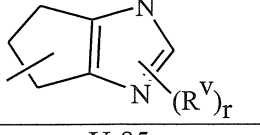
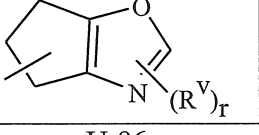
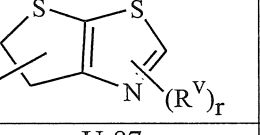
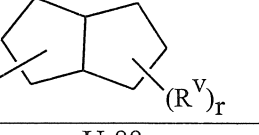
Bảng cấu trúc 1

	,		,		,		,		,
U-1		U-2		U-3		U-4		U-5	
	,		,		,		,		,
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	

	,		,		,		,		,
U-46		U-47		U-48		U-49		U-50	
	,		,		,		,		,
U-51		U-52		U-53		U-54		U-55	
	,		,		,		,		an
U-56		U-57		U-58		U-59		U-60	
	,								
U-61									

Như nêu trên, Q^a có thể là (trong số các nhóm khác) hệ vòng hai vòng có 8, 9 hoặc 10 cạnh được dung hợp ortho tùy ý được thể bằng một hoặc nhiều các phần tử thể được chọn từ nhóm bao gồm các phần tử thể như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế. Ví dụ về hệ vòng hai vòng có 8, 9 hoặc 10 cạnh được dung hợp ortho tùy ý được thể bằng from một hoặc nhiều các phần tử thể bao gồm các vòng U-81 đến U-123 được thể hiện trong bảng cấu trúc 3, trong đó R^v là phần tử thể bất kỳ như được định nghĩa trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế đối với Q^a , và r là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 4.

Bảng cấu trúc 3

	,		,		,		,
U-81		U-82		U-83		U-84	
	,		,		,		,
U-85		U-86		U-87		U-88	

U-89	U-90	U-91	U-92
U-93	U-94	U-95	U-96
U-97	U-98	U-99	U-100
U-101	U-102	U-103	U-104
U-105	U-106	U-107	U-108
U-109	U-110	U-111	U-112
U-113	U-114	U-115	U-116
U-117	U-118	U-119	U-120
		and	
U-121	U-122	U-123	

Mặc dù các nhóm R^V được thể hiện trong công thức cấu tạo U-1 đến U-123, lưu ý rằng chúng không cần thiết có mặt do chúng là các phân tử thế tùy ý. Lưu ý rằng khi R^V là H khi được gắn vào nguyên tử, điều này cũng giống như khi nguyên tử này không được thế. Nguyên tử nitơ cần thế để điền đầy hóa trị của chúng được thế bằng H hoặc R^V . Lưu ý rằng khi điểm gắn giữa $(R^V)_r$ và nhóm U được thể hiện dưới dạng đường thay đổi, $(R^V)_r$ có thể được gắn vào nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bất kỳ của nhóm U. Lưu ý rằng

khi điểm gắn trên nhóm U được thể hiện dưới dạng đường thay đổi, nhóm U có thể được gắn vào phần còn lại có công thức (1) thông qua nguyên tử cacbon hoặc nitơ có sẵn bất kỳ của nhóm U bằng cách thay thế nguyên tử hydro. Lưu ý rằng một số nhóm U có thể chỉ được thể bằng nhỏ hơn 4 nhóm R^v (ví dụ U-2 đến U-5, U-7 đến U-48, và U-52 đến U-61).

Dị vòng và hệ vòng thơm và không thơm có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp đã biết trong lĩnh vực này; để biết thêm thông tin xem *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 và *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 tồn tại dưới dạng một hoặc nhiều chất đồng phân lập thể. Chất đồng phân lập thể là các chất đồng phân có cấu trúc giống hệt nhau nhưng khác nhau về cách thức bố trí của các 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 (cũng được gọi là chất đồng phân hình học) và chất đồng phân không quay. Chất đồng phân không quay thu được từ hiệu ứng quay giới hạn xung quanh các liên kết đơn ở đó hàng rào quay là đủ lớn để cho phép phân lập các chất đồng phân. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng một chất đồng phân lập thể có thể có hoạt tính cao hơn và/hoặc tác dụng có lợi mạnh hơn khi được làm giàu so với các chất đồng phân lập thể khác hoặc khi được phân tách khỏi các chất đồng phân lập thể khác. Ngoài ra, phương pháp phân tách, làm giàu và/hoặc điều chế chọn lọc các chất đồng phân lập thể này là đã biết trong lĩnh vực này. Để biết thêm thông tin về toàn bộ các chất đồng phân lập thể, xem Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Sáng chế bao gồm toàn bộ các chất đồng phân lập thể, chất đồng phân cấu hình và hỗn hợp của chúng ở toàn bộ các tỷ lệ phần trăm cũng như các dạng chứa đồng vị, như hợp chất được đơteri hóa.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng không phải toàn bộ các dị vòng chứa nitơ có thể tạo thành N-oxit do nitơ cần một cặp điện tử duy nhất để oxy hóa thành oxit; nên người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ nhận ra được các dị vòng chứa nitơ có thể tạo thành N-oxit. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực

này cũng sẽ nhận ra rằng amin bậc ba có thể tạo thành *N*-oxit. Các phương pháp điều chế *N*-oxit của dị vòng và amin bậc ba là đã biết trong lĩnh vực này bao gồm phương pháp oxy hóa dị vòng và amin bậc ba bằng axit peroxy, như axit peraxetic và axit 3-cloperbenzoic (MCPBA), hydro peroxit, alkyl hydroperoxit, như *t*-butyl hydroperoxit, natri perborat, và đioxiran, như dimetylđioxiran. Các phương pháp điều chế *N*-oxit này được mô tả trong các tài liệu 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; và 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 trung bình trong lĩnh vực này hiểu rằng do trong môi trường và điều kiện sinh lý muối của hợp chất hóa học cân bằng với dạng không muối của nó, muối có cùng hoạt tính sinh học của dạng không muối. Do đó, nhiều muối của hợp chất có công thức (1) hữu ích để kiểm soát dịch hại không xương sống. Muối của hợp chất có công thức (1) bao gồm muối cộng hợp axit với axit hữu cơ hoặc vô cơ, như axit hydrobromic, hydrocloric, nitric, phosphoric, sulfuric, axetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salixylic, tartaric, 4-toluensulfonic hoặc valeric. Khi hợp chất có công thức (1) chứa gốc có tính axit, như axit carboxylic hoặc phenol, muối cũng bao gồm muối được điều chế từ bazơ vô cơ hoặc hữu cơ, như pyridin, trietylamin hoặc amoniac, hoặc amit, hydrit, hydroxit hoặc natri carbonat, kali carbonat, lithi carbonat, canxi carbonat, magie carbonat hoặc bari carbonat. Theo đó, sáng chế bao gồm hợp chất có công thức (1), *N*-oxit và muối thích hợp của nó.

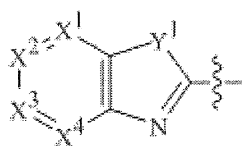
Hợp chất có công thức (1), chất đồng phân lập thể, chất đồng phân hỗn hợp, *N*-oxit, và muối của nó, có thể tồn tại ở nhiều hơn một dạng, do đó hợp chất có công thức (1) bao gồm toàn bộ các dạng tinh thể và phi tinh thể của hợp chất có công thức (1). Các dạng phi tinh thể bao gồm các dạng rắn, như sáp và gom cũng như dạng lỏng, như dung dịch và dạng nóng chảy. Các dạng tinh thể bao gồm dạng tinh thể đơn và hỗn hợp chứa các dạng đa hình (tức là các dạng tinh thể khác nhau). Thuật ngữ “dạng đa hình” được dùng trong

bản mô tả để chỉ dạng tinh thể cụ thể của hợp chất hóa học có thể kết tinh ở các dạng tinh thể khác nhau, các dạng này có cách thức bố trí và/hoặc cấu hình khác nhau của các phân tử trong mạng tinh thể. Mặc dù các dạng đa hình có thể có cùng thành phần hóa học, chúng cũng có thể khác nhau về thành phần do có mặt hoặc vắng mặt của nước được đồng kết tinh hoặc các phân tử khác, có thể liên kết mạnh hoặc yếu trong mạng tinh thể. Các dạng đa hình này có thể khác nhau về tính chất hóa học, vật lý và sinh học, như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ ổn định hoá học, nhiệt độ nóng chảy, độ hút ẩm, khả năng thấm và ổn định, tỷ lệ hòa tan và độ sinh khả dụng. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng dạng đa hình của hợp chất có công thức (1) có thể có tác dụng có lợi (ví dụ độ thích hợp điều chế các chế phẩm nông dụng hữu ích, hoạt tính sinh học được cải thiện) cao hơn một dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp chứa các dạng đa hình của cùng hợp chất có công thức (1). Dạng đa hình cụ thể của hợp chất có công thức (1) có thể được điều chế và phân lập bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực này bao gồm, ví dụ phương pháp kết tinh sử dụng nhiệt độ và dung môi chọn lọc. Hợp chất theo sáng chế có thể tồn tại dưới dạng một hoặc nhiều dạng tinh thể đa hình. Sáng chế bao gồm cả các dạng đa hình riêng lẻ và hỗn hợp chứa các dạng đa hình, bao gồm hỗn hợp chứa nhiều một dạng đa hình so với các dạng đa hình khác. Để biết thêm thông tin về dạng đa hình, xem R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

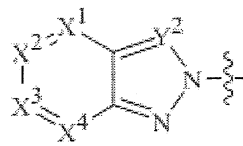
Các phương án theo sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án mô tả dưới đây. Trong các phương án sau, liên quan đến “hợp chất có công thức (1)” bao gồm các định nghĩa của các phân tử thể được thể hiện trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có quy định khác trong các phương án này.

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

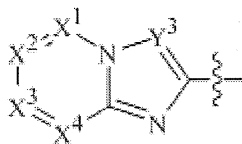
Q là



Q-1

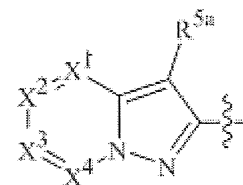


Q-2



Q-3

hoặc



Q-4

A là CH, CR¹ hoặc N;

mỗi R¹ độc lập là halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio hoặc C₁-C₄ haloalkylthio;

m bằng 0, 1, 2 hoặc 3;

X¹, X², X³ và X⁴ độc lập với nhau là CR², CR³ hoặc N, với điều kiện là (i) một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là CR², và (ii) không nhiều hơn một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là N;

R² là C(=Z)R¹¹, N(R⁸)C(=NR⁸)R⁹, LQ^a, hoặc C₁-C₄ alkyl được thế bằng C(=Z)R¹¹ hoặc C(=Z)NR⁶R⁷;

L là O, S(O)_n, NR⁸ hoặc C(=Z);

mỗi Z độc lập là O hoặc S;

mỗi R³ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy hoặc C₁-C₄ haloalkoxy;

Y¹ là O, S hoặc NR⁴;

Y² là N hoặc CR^{5a};

Y³ là N hoặc CR^{5b};

R⁴ là H hoặc C₁-C₄ alkyl;

R^{5a} là H, halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy hoặc C₁-C₄ haloalkoxy;

R^{5b} là H, halogen, xyano, nitro, C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^6 là H, $NR^{15}R^{16}$, OR^{17} , $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ;

R^7 là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ; hoặc

R^6 và R^7 cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 R^x ; hoặc

R^6 và R^7 cùng với nhau là $=S(O)_pR^{18}R^{19}$ hoặc $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_3 - C_6 xycloalkoxy, $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $OC(O)R^{22}$, $NR^{25}R^{26}$, $NR^{24}C(O)R^{22}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$, $Si(R^{28})_3$, $OSi(R^{28})_3$ hoặc Q^b ;

R^8 là H, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ;

R^9 là H, $C(=NR^{10})R^{11}$, OR^{21} hoặc $NR^{15}R^{16}$; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ; hoặc phenyl, phenoxy hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử 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 1 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và

C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁰ độc lập là OR¹², S(O)_nR¹³ hoặc NHR¹⁴;

mỗi R¹¹ độc lập là H; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²² hoặc Q^b;

mỗi R¹² độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²², S(O)_nR¹³ hoặc Q^b;

mỗi R¹³ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl;

R¹⁴ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²² hoặc C(O)OR²¹; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁵ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²⁷ hoặc S(O)₂R²⁷; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁶ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc

R¹⁵ và R¹⁶ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

R^{17} là C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{18} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{19} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{18} và R^{19} cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào tạo thành vòng;

R^{20} là H, xyano, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc $C(O)R^{22}$; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{21} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{22} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl; C_3 - C_6 haloxycloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkylalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkylalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1 - C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} độc lập cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{27} độc lập là C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy hoặc $NR^{29}R^{30}$; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{28} độc lập là C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R^{29} độc lập là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, 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_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{30} độc lập là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R²⁹ và R³⁰ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

Q^a là vòng hoặc hệ vòng thơm có 5 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử độc lập được chọn từ một nguyên tử oxy, một nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc vòng no một phần có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2.

Phương án 1a. Hợp chất có công thức (1), trong đó

Q là Q-2;

A là CH, CR¹ hoặc N;

mỗi R¹ độc lập là halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio hoặc C₁-C₄ haloalkylthio;

m bằng 0 hoặc 1;

X¹, X², X³ và X⁴ độc lập với nhau là CR², CR³ hoặc N, với điều kiện là (i) một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là CR², và (ii) không nhiều hơn một trong số các nhóm X¹, X², X³ và X⁴ là N;

R² là C(=Z)R¹¹;

mỗi Z độc lập là O hoặc S;

mỗi R³ độc lập là H, halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy hoặc C₁-C₄ haloalkoxy;

Y² là N hoặc CR^{5a};

R^{5a} là H, halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy hoặc C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ hoặc Q^b;

R⁸ là H, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R⁹ là H, C(=NR¹⁰)R¹¹, OR²¹ hoặc NR¹⁵R¹⁶; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc phenyl, phenoxy hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử 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 1 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁰ độc lập là OR¹², S(O)nR¹³ hoặc NHR¹⁴;

mỗi R¹¹ độc lập là H; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²² hoặc Q^b;

mỗi R¹² độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²², S(O)_nR¹³ hoặc Q^b;

mỗi R¹³ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl;

R¹⁴ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²² hoặc C(O)OR²¹; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁵ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C(O)R²⁷ hoặc S(O)₂R²⁷; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁶ độc lập là H, C₁-C₆ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc

R¹⁵ và R¹⁶ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

R¹⁷ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁸ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁹ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R¹⁸ và R¹⁹ cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào tạo thành vòng;

R²⁰ là H, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl hoặc C(O)R²²; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²¹ độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₃-C₆ haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²² độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₃-C₆ haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_6 haloxyccloalkyl, C_3-C_6 xycloalkylalkyl hoặc C_3-C_6 haloxyccloalkylalkyl; hoặc phenyl, 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_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1-C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} độc lập cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng 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_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{27} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkoxy hoặc $NR^{29}R^{30}$; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy và C_1-C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{28} độc lập là C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R^{29} độc lập là H hoặc Q^b ; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R³⁰ độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R²⁹ và R³⁰ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

Q^a là vòng hoặc hệ vòng thơm có 5 đến 10 cạnh, mỗi vòng hoặc hệ vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử độc lập được chọn từ một nguyên tử oxy, một nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, trong đó tối đa 2 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng hoặc hệ vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc vòng no một phần có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng

độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một phần tử thể độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2.

Phương án 1b. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1, Q-2 hoặc Q-3.

Phương án 2. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1, Q-2 hoặc Q-3, và Y³ là CR^{5b}.

Phương án 3. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1 hoặc Q-2.

Phương án 4. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1.

Phương án 5. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1, và Y¹ là O hoặc S.

Phương án 6. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1, và Y¹ là S.

Phương án 7. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-1, và Y¹ là O.

Phương án 8. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-2.

Phương án 9. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-2, và Y² là CR^{5a}.

Phương án 9a. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-2, Y² là CR^{5a}, và R^{5a} là H.

Phương án 10. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 9, trong đó A là CH, CR¹ hoặc N, và R¹ là halogen.

Phương án 11. Hợp chất theo phương án 10, trong đó A là CH, CF hoặc N.

Phương án 11a. Hợp chất theo phương án 10, trong đó A là CF hoặc N.

Phương án 12. Hợp chất theo phương án 10, trong đó A là CH hoặc CF.

Phương án 13. Hợp chất theo phương án 10, trong đó A là CH.

Phương án 14. Hợp chất theo phương án 10, trong đó A là N.

Phương án 15. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 9, trong đó m bằng 1, và R^1 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc halogen.

Phương án 16. Hợp chất theo phương án 15, trong đó R^1 là CF_3 , OMe, Me, hoặc F.

Phương án 17. Hợp chất theo phương án 16, trong đó R^1 là CF_3 , OMe, Me, hoặc F, và nhóm thế này ở vị trí số 4.

Phương án 18. Hợp chất theo phương án 17, trong đó R^1 là CF_3 , và nhóm thế này ở vị trí số 4.

Phương án 19. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 9, trong đó m bằng 0.

Phương án 20. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 19, trong đó X^1 là CR^2 ; hoặc X^2 là CR^2 .

Phương án 20a. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 19, trong đó X^1 là CR^2 , và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 ; hoặc X^2 là CR^2 , và X^1 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 .

Phương án 20b. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 19, trong đó X^1 là CR^2 , và một trong số các nhóm X^2 , X^3 và X^4 là N; hoặc X^2 là CR^2 , và một trong số các nhóm X^1 , X^3 và X^4 là N.

Phương án 21. Hợp chất theo phương án 20, trong đó X^1 là CR^2 , và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 .

Phương án 22. Hợp chất theo phương án 20, trong đó X^2 là CR^2 , và X^1 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 .

Phương án 23. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 22, trong đó mỗi R^3 độc lập là H hoặc halogen.

Phương án 24. Hợp chất theo phương án 23, trong đó mỗi R^3 độc lập là H hoặc F.

Phương án 25. Hợp chất theo phương án 24, trong đó mỗi R^3 là H.

Phương án 26. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$, LQ^a , hoặc C_1 - C_4 alkyl được thế bằng $C(=Z)R^{11}$ hoặc $C(=Z)NR^6R^7$.

Phương án 27. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$, hoặc C_1-C_4 alkyl được thế bằng $C(=Z)R^{11}$ hoặc $C(=Z)NR^6R^7$.

Phương án 28. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$ hoặc LQ^a .

Phương án 29. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án 30. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a .

Phương án 31. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a và L là O.

Phương án 32. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a và L là S.

Phương án 33. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a và L là NR^8 .

Phương án 35. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a và L là $C(O)$.

Phương án 38. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a ; và Q^a là phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x .

Phương án 39. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là LQ^a ; và Q^a là dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử độc lập được chọn từ một nguyên tử oxy, một nguyên tử lưu huỳnh, và tối đa 3 nguyên tử nitơ, mỗi vòng này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x .

Phương án 40. Hợp chất theo phương án 39, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 5 cạnh.

Phương án 41. Hợp chất theo phương án 40, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 5 cạnh có nguyên tử nitơ ở vị trí số 2.

Phương án 42. Hợp chất theo phương án 39, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 6 cạnh.

Phương án 43. Hợp chất theo phương án 42, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ ở vị trí số 2.

Phương án 43a. Hợp chất theo phương án 42, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 6 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng 1-2 R^x .

Phương án 44. Hợp chất theo phương án 43, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ ở vị trí số 2 và được thế bằng C_1-C_4 haloalkyl.

Phương án 45. Hợp chất theo phương án 44, trong đó dị vòng thơm này là dị vòng thơm có 6 cạnh có nguyên tử nitơ ở vị trí số 2 và được thế bằng CF_3 .

Phương án 46. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$ hoặc LQ^a ; hoặc C_1-C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1-C_4 alkyl được thế bằng $C(=Z)R^{11}$ hoặc $C(=Z)NR^6R^7$, và tùy còn được thế tối đa bằng 3 R^y .

Phương án 47. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=O)R^{11}$ hoặc LQ^a ; hoặc C_1-C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1-C_2 alkyl được thế bằng $C(=O)NR^6R^7$, và tùy còn được thế tối đa bằng 3 R^y .

Phương án 48. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=O)R^{11}$; hoặc C_1-C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1-C_2 alkyl được thế bằng $C(=O)NR^6R^7$, và tùy còn được thế tối đa bằng 3 R^y .

Phương án 49. Hợp chất có công thức (1) hoặc hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ 1 đến 25, trong đó R^2 là $C(=O)R^{11}$ hoặc C_1-C_6 alkoxy; hoặc C_1-C_2 alkyl được thế bằng $C(=O)NR^6R^7$.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án từ 1 đến 49 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong sáng chế, có thể được kết hợp theo cách thức bất kỳ, và phần mô tả các nhóm thế trong các phương án này không chỉ liên quan đến hợp chất có công thức (1) mà còn liên quan đến hợp chất ban đầu và 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 đến 49 nêu trên cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong sáng chế, và tổ hợp bất kỳ của chúng, liên quan đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Tổ hợp của các phương án 1 đến 49 được thể hiện bởi:

Phương án A. Hợp chất có công thức (1), trong đó X^1 hoặc X^2 là CR^2 .

Phương án B. Hợp chất theo phương án A, trong đó Q là Q-1 hoặc Q-2.

Phương án C. Hợp chất theo phương án B, trong đó Q là Q-1; và Y^1 là O hoặc S.

Phương án D. Hợp chất theo phương án B, trong đó Q là Q-2; và Y^2 là CR^{5a} .

Phương án E. Hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án từ A đến D, trong đó A là CH hoặc CF; và m bằng 0.

Phương án F. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH hoặc CF; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; X^1 là CR^2 và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CH; hoặc X^2 là CR^2 và X^1 , X^3 và X^4 là CH; R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án G. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH hoặc CF; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; X^1 là CR^2 và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CH; R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án H. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH hoặc CF; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; X^2 là CR^2 và X^1 , X^3 và X^4 là CH; R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án I. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; R5a là H; X^1 là CR^2 và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CH; hoặc X^2 là CR^2 và X^1 , X^3 và X^4 là CH; và R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án J. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; R5a là H; X^1 là CR^2 và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CH; và R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Phương án K. Hợp chất có công thức (1), trong đó A là CH; m bằng 0; Q là Q-2; Y^2 là CR^{5a} ; R5a là H; X^2 là CR^2 và X^1 , X^3 và X^4 là CH; và R^2 là $C(=Z)R^{11}$.

Tổ hợp khác của các phương án 1-45 bao gồm:

Phương án A1. Hợp chất có công thức (1), trong đó Q là Q-2; và Y^2 là CR^{5a} .

Phương án A2. Hợp chất theo phương án A1, trong đó X^1 là CR^2 ; hoặc X^2 là CR^2 .

Phương án A3. Hợp chất theo phương án A2, trong đó X^1 là CR^2 , và X^2 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 hoặc X^2 là CR^2 , và X^1 , X^3 và X^4 độc lập với nhau là CR^3 .

Phương án A4. Hợp chất theo phương án A2, trong đó X^1 là CR^2 , và một trong số các nhóm X^2 , X^3 và X^4 là N; hoặc X^2 là CR^2 , và một trong số các nhóm X^1 , X^3 và X^4 là N.

Phương án A5. Hợp chất theo phương án A2, trong đó R^2 là $C(=Z)R^{11}$ hoặc LQ^a ; hoặc C_1 - C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1 - C_4 alkyl được thế bằng $C(=Z)R^{11}$ hoặc $C(=Z)NR^6R^7$, và tùy còn được thế tối đa bằng 3 R^y .

Phương án A6. Hợp chất theo phương án A5, trong đó $C(=O)R^{11}$ hoặc LQ^a ; hoặc C_1 - C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1 - C_2 alkyl được thế bằng $C(=O)NR^6R^7$, và tùy còn được thế tối đa bằng 3 R^y ; L là O; và Q^a là dị vòng thơm có 6 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng 1-2 R^x .

Phương án A7. Hợp chất theo phương án A6, trong đó A là CH, CF hoặc N; và m bằng 0.

Phương án A8. Hợp chất theo phương án A7, trong đó A là CH hoặc CF.

Theo các phương án cụ thể, sáng chế đề xuất hợp chất có công thức (1) được chọn từ nhóm bao gồm (hợp chất được đánh số theo Bảng chỉ số A): 3-(methylthio)-1-[2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-yl]-1-propanon (hợp chất 2); 3-(metoxymethylamino)-1-[2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-yl]-1-propanon (hợp chất 32); 2-(3-pyridinyl)-5-(2-pyrimidinylloxy)-2*H*-indazol (hợp chất 42); α -oxo-2-(3-pyridinyl)-*N*-(2,2,2-trifloetyl)-2*H*-indazol-5-axetamit (hợp chất 48); 5-(2-methylpropoxy)-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol (hợp chất 54); α -metyl-2-(3-pyridinyl)-*N*-(2-pyrimidinylmetyl)-2*H*-indazol-5-axetamit (hợp chất 59); 2-(3-pyridinyl)-*N*-(2-pyrimidinylmetyl)-2*H*-indazol-5-axetamit (hợp chất 84); và *N*-(1-xyano-1-metyletyl)- α -metyl-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetamit (hợp chất 85).

Hợp chất theo sáng chế khác biệt ở chỗ có đặc tính chuyển hóa và/hoặc tồn dư trong đất nổi trội và có hoạt tính kiểm soát dịch hại không xương sống nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Đặc biệt là, vì lý do phổ kiểm soát dịch hại không xương sống và tầm quan trọng kinh tế, bảo vệ cây trồng nông nghiệp khỏi tổn thương hoặc thiệt hại gây ra bởi dịch hại không xương sống bằng cách kiểm soát dịch hại không xương sống là các phương án theo sáng chế. Do do đặc tính dễ vận chuyển hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, nên hợp chất theo sáng chế cũng bảo vệ tán lá hoặc các bộ phận khác của thực vật không tiếp xúc trực tiếp với hợp chất có công thức (1) hoặc chế phẩm trừ dịch hại, chứa hợp chất này.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong sáng chế, 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 rắn chất pha loãng và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế cũng đề xuất chế phẩm kiểm soát dịch hại không xương sống, chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, cũng như các phương án bất kỳ khác được mô tả trong sáng chế, 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 rắn chất pha loãng và chất pha loãng dạng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế).

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm trừ dịch hại, chứa hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên, ở dạng chế phẩm dạng lỏng tưới đất. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống bao gồm bước cho đất tiếp xúc với chế phẩm dạng lỏng tưới đất chứa lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm phun để kiểm soát dịch hại không xương sống chứa lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên và chất đẩy. Sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm thuốc môi để kiểm soát dịch hại không xương sống chứa lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các

phương án nêu trên, một hoặc nhiều nguyên liệu thực phẩm, tùy ý chất thu hút, và tùy ý chất giữ ẩm. Sáng chế cũng đề cập đến thiết bị để kiểm soát dịch hại không xương sống chứa chế phẩm thuốc môi này và hộp được thiết kế để tiếp nhận chế phẩm thuốc môi này, trong đó hộp này có ít nhất một khe hở được tạo kích cỡ để cho phép dịch hại không xương sống chạy qua khe hở này sao cho dịch hại không xương sống có thể ăn chế phẩm thuốc môi này từ vị trí bên ngoài hộp, và hộp này tiếp tục được điều chỉnh để được đặt trong hoặc gần vùng sinh sống hoặc đã biết đối với dịch hại không xương sống.

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi dịch hại không xương sống bao gồm bước cho hạt giống này tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Sáng chế cũng mô tả phương pháp bảo vệ động vật khỏi dịch hại ký sinh không xương sống bao gồm bước cho động vật này sử dụng lượng hữu hiệu của hợp chất theo phương án bất kỳ trong số các phương án nêu trên.

Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, (ví dụ chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế), với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp điều trị bệnh cho người hoặc động vật.

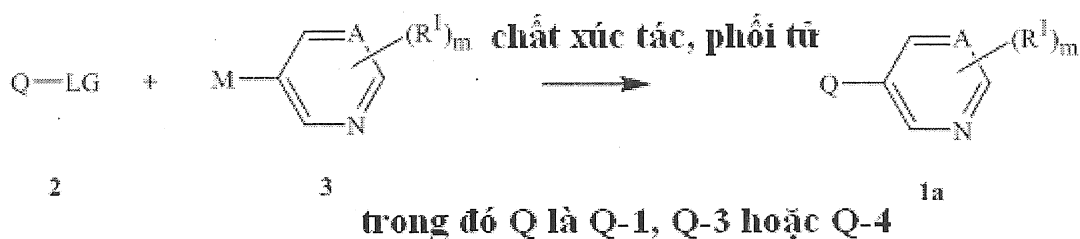
Sáng chế cũng đề xuất phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của chế phẩm trừ dịch hại, chứa lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, và ít nhất một thành 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, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa lượng hữu hiệu của ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp điều trị bệnh cho người hoặc động vật.

Hợp chất có công thức (1) có thể được điều chế bằng một hoặc nhiều phương pháp sau và biến thể của phương pháp này như được mô tả trong sơ đồ 1-12. Các phần tử thể trong các hợp chất có công thức (1)-(22) được định nghĩa như nêu trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, trừ khi có quy định khác. Hợp chất có công thức (1a)-(1f) là các phân nhóm khác nhau của hợp chất có công thức (1), và toàn bộ các phần tử thể trong

hợp chất có công thức (1a)-(1f) được định nghĩa như nêu trong hợp chất có công thức (1). Các ký hiệu 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 (1a) (công thức (1), trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4) có thể được điều chế theo sơ đồ 1 bằng cách ghép cặp hợp chất dị vòng có công thức (2) (trong đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp, như Cl, Br, I, Tf hoặc Nf) với hợp chất dị vòng có công thức (3) (trong đó M là kim loại hoặc á kim thích hợp, nhưng, Zn hoặc B) trong sự có mặt của chất xúc tác và phối tử thích hợp. Các chất xúc tác có thể được điều chế từ các kim loại chuyển tiếp, như Pd (ví dụ Pd(OAc)₂ hoặc Pd₂(dba)₃ và các phối tử mono-đentat hoặc bi-đentat, như PPh₃, PCy₃, Pt-Bu₃, x-phos, xantphos, s-phos, và dppf. Các bazơ thông thường được sử dụng bao gồm carbonat, như natri carbonat hoặc xeri carbonat, phosphat, như kali triphosphat, amin, như etylđiisopropylamin, hoặc alkoxit, như natri tert-butoxit. Các dung môi bao gồm THF, đioxan, toluen, etanol, DMF, nước hoặc hỗn hợp của chúng. Nhiệt độ phản ứng thường nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến nhiệt độ sôi của dung môi.

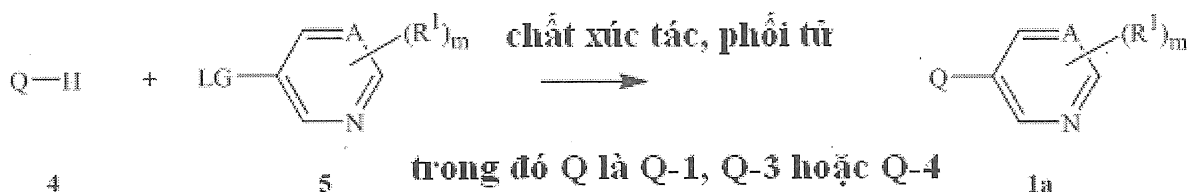
Sơ đồ 1



Hợp chất có công thức (1a) (công thức (1), trong đó Q là Q-1, Q-3 hoặc Q-4) cũng có thể được điều chế theo sơ đồ 2 bằng cách ghép cặp hợp chất có công thức (4) với hợp chất có công thức (5) (trong đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp, như Cl, Br, I, Tf hoặc Nf) trong sự có mặt của chất xúc tác và phối tử thích hợp. Một số chất xúc tác có thể được sử dụng trong phương pháp theo sơ đồ 2, và chất xúc tác này có thể được điều chế từ các kim loại chuyển tiếp, như đồng hoặc Pd (ví dụ phức chất, như Pd(OAc)₂ hoặc Pd₂(dba)₃) và phối tử. Các phối tử thông thường có thể là mono-đentat hoặc bi-đentat, và bao gồm PPh₃, PCy₃, Pt-Bu₃, x-phos, xantphos, s-phos, và dppf. Các bazơ thông thường được sử dụng bao gồm carbonat, như natri carbonat hoặc xeri carbonat, phosphat, như

kali triphosphat, amin, như etyldiisopropylamin hoặc alkoxit, như natri tert-butoxit. Các chất bổ trợ, như các hợp chất rây phân tử, $\text{Bu}_4\text{N}^+\text{Br}^-$ hoặc muối đồng hoặc muối bạc (ví dụ AgOAc) có thể có lợi. Các dung môi phản ứng bao gồm THF, đioxan, toluen, etanol, DMF, nước, hoặc hỗn hợp của chúng. Nhiệt độ phản ứng thường nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến nhiệt độ sôi của dung môi. Ví dụ, see *Chemical Communications* 2011, 47(17), pp. 5043-5045; *Journal of the American Chemical Society* 2010, 132(11), pp. 3674-3675; *Heterocycles* 2011, 83(6), pp. 1371-1376; Đơn công bố Patent Mỹ số 20090076266; *Bulletin of the Chemical Society of Japan* 1998, 71(2), pp. 467-473; *Tetrahedron Letters* 2008, 49(10), pp. 1598-1600; và *Tetrahedron Letters* 2010, 51(42), pp. 5624-5627.

Sơ đồ 2



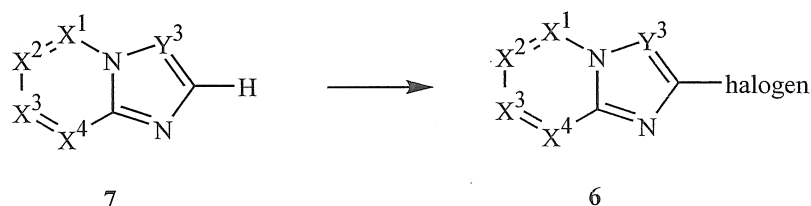
Hợp chất có công thức (2), trong đó LG là halogen có thể được điều chế từ amin tương ứng bằng cách xử lý với nguồn ON^+ , như isoamyl nitrit hoặc t-butyl nitrit hoặc axit nitơ trong sự có mặt của nguồn halogen, như CuBr_2 hoặc $\text{BnNEt}_3^+\text{Br}^-$. Tốt hơn nếu các điều kiện phản ứng bao gồm dung môi chứa nước hoặc dung môi hữu cơ, như THF hoặc axetonitril, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 0°C đến nhiệt độ sôi của dung môi.

Hợp chất có công thức (2), trong đó LG là Cl hoặc Br cũng có thể được điều chế từ hợp chất hydroxy tương ứng bằng cách xử lý với hợp chất halogen hóa, như POCl_3 , PCl_5 , PBr_3 hoặc SOCl_2 . Hợp chất có công thức (2), trong đó LG là OMS hoặc OTf cũng có thể được điều chế từ hợp chất hydroxy tương ứng bằng cách xử lý với MsCl hoặc Tf_2O .

Hợp chất có công thức (4) có thể được điều chế từ hợp chất amin tương ứng bằng cách xử lý với nguồn ON^+ , như isoamyl nitrit hoặc t-butyl nitrit. Tốt hơn nếu các điều kiện phản ứng bao gồm dung môi ete, như THF ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến nhiệt độ sôi của dung môi.

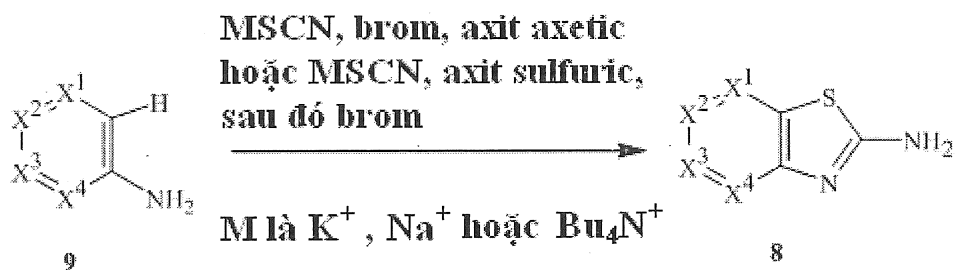
Hợp chất có công thức (6) có thể được điều chế bằng phản ứng halogen hóa ái điện tử hợp chất có công thức (7) tương ứng bằng cách xử lý với hợp chất halogen hóa, như *N*-bromosuccinimit trong dung môi thích hợp, như DMF, NMP hoặc axit axetic ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường lên đến nhiệt độ sôi của dung môi (Sơ đồ 3).

Sơ đồ 3



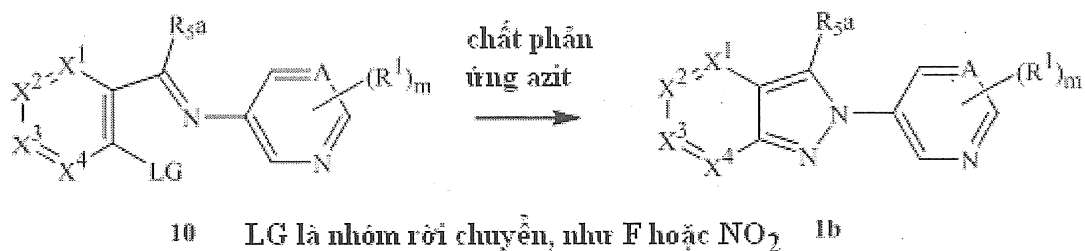
Hợp chất 2-aminobenzothiazol có công thức (8) có thể được điều chế từ anilin không được thế ở vị trí ortho có công thức (9) và anion thioxyanat (trong đó M là K^+ , Na^+ hoặc Bu_4N^+) như được thể hiện trong sơ đồ 4. Phản ứng này có thể được thực hiện trong một bước trong axit axetic, hoặc thông qua hợp chất trung gian thio-ure sau đó thực hiện phản ứng oxy hóa. Các chất oxy hóa thích hợp bao gồm brom.

Sơ đồ 4



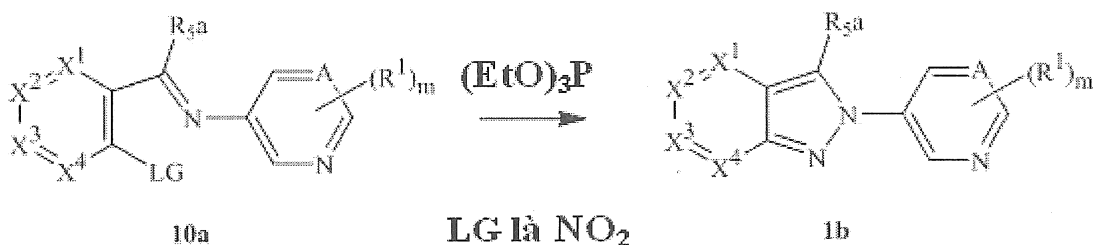
Hợp chất có công thức (1b) có thể được điều chế từ có công thức (10) bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 5, trong đó hợp chất có công thức (10) được xử lý với chất phản ứng azit (ví dụ, natri azit hoặc tetrabutylamoni azit). Các điều kiện phản ứng bao gồm dung môi là DMF hoặc NMP, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 80°C đến nhiệt độ sôi của dung môi.

Sơ đồ 5



Hợp chất có công thức (1b) cũng có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (10a) bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 5a, trong đó hợp chất có công thức (10a) được xử lý với triethyl phosphit.

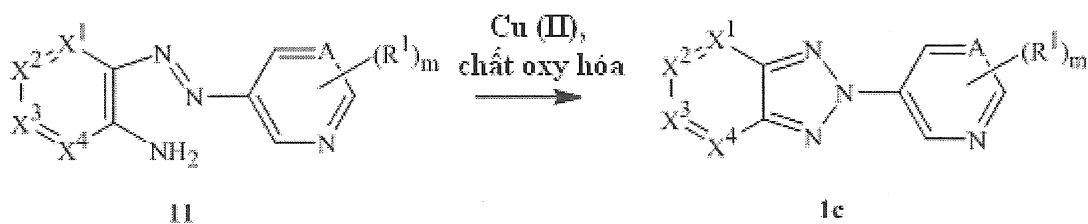
Sơ đồ 5a



Hợp chất có công thức (10) và (10a) là các bazơ Schiff có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực này (ví dụ, xem March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, pp. 896-898).

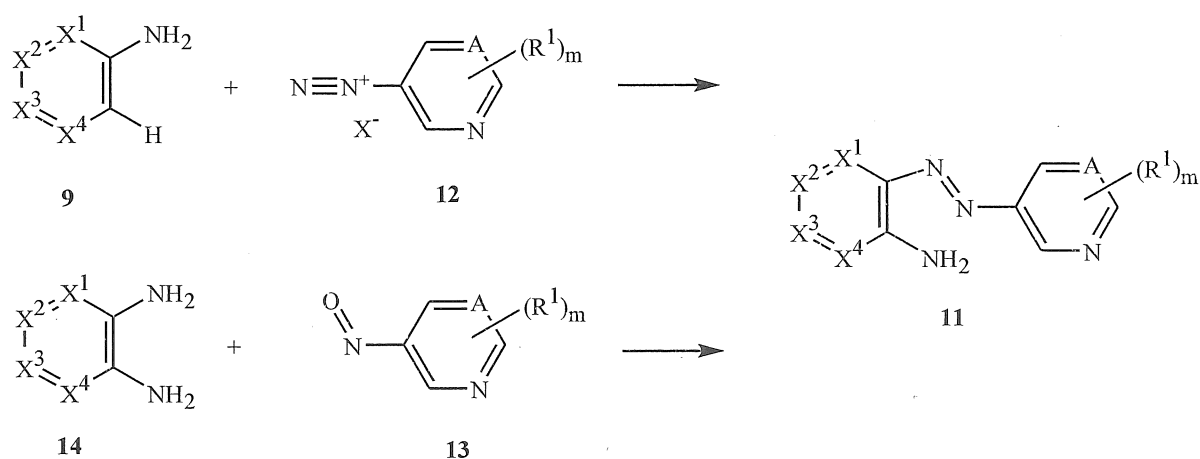
Hợp chất có công thức (1c) có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (11) bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 6 thông qua phản ứng oxy hóa hợp chất có công thức (11) với oxy phân tử hoặc peroxit, như t-butyl hydroperoxit trong sự có mặt của chất xúc tác đồng (II), như Cu(OAc)₂ hoặc CuBr₂. Các điều kiện phản ứng bao gồm dung môi rượu, như rượu t-amyllic, DMF, NMP hoặc nước amoniac, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ 60°C đến nhiệt độ sôi của dung môi.

Sơ đồ 6



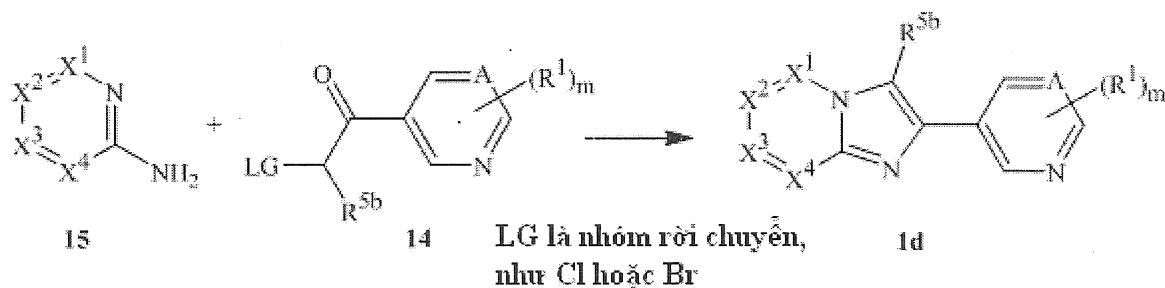
Hợp chất 2-aminoazo có công thức (11) có thể được điều chế bằng phản ứng của anilin có công thức (9) với muối diazoni có công thức (12) bằng cách phương pháp đã biết trong lĩnh vực này (ví dụ, xem March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, pp. 525-526). Hợp chất có công thức (11) cũng có thể được điều chế bằng phản ứng của hợp chất aryl nitroso có công thức (13) với diamin có công thức (14) trong dung môi, như axit axetic. Hai phương pháp này được thể hiện trong sơ đồ 7.

Sơ đồ 7



Hợp chất có công thức (1d) có thể được điều chế bằng phản ứng ngưng tụ hợp chất có công thức (14) (trong đó LG là nhóm rời chuyển thích hợp, như Cl hoặc Br) với aminopyridin hoặc aminodiazin có công thức (16) như được thể hiện trong sơ đồ 8. Các điều kiện phản ứng bao gồm dung môi rượu, như etanol hoặc toluen, và nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng từ nhiệt độ môi trường đến nhiệt độ sôi của dung môi. Nitơ pyridin có thể tùy ý được bảo vệ dưới dạng sản phẩm cộng hợp BH_3 , N-oxit, hoặc dẫn xuất 2-halopyridin hoặc 6-halopyridin.

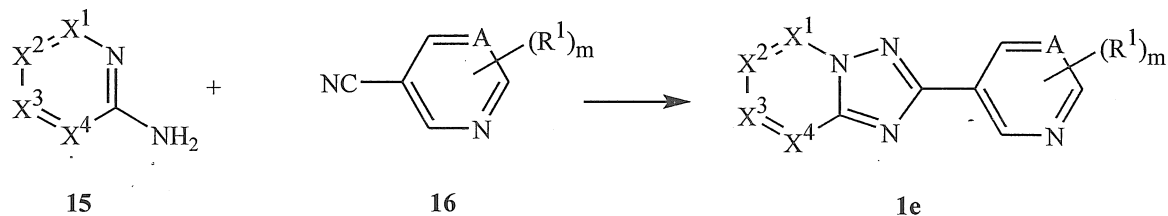
Sơ đồ 8



Hợp chất có công thức (1e) có thể được điều chế theo sơ đồ 9 bằng phản ứng cộng hợp xyclo 2-aminopyridin có công thức (15) với aryl nitril có công thức (16) (ví dụ, xem

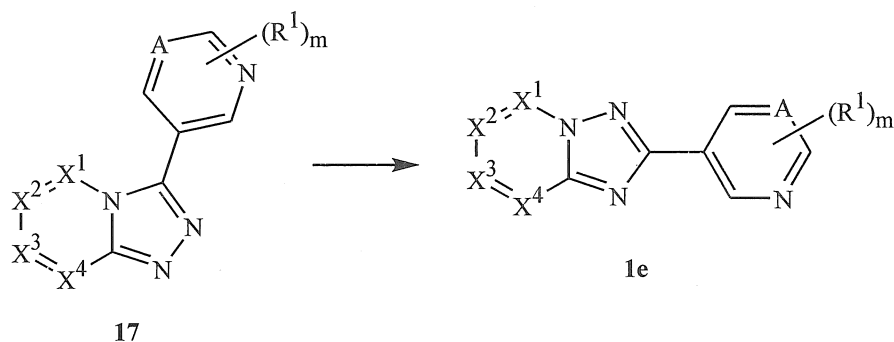
Journal of the American Chemical Society 2009, 131(42), pp. 15080-15081, và WO2013041472.

Sơ đồ 9



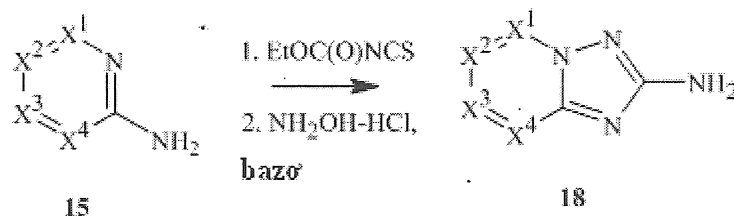
Hợp chất có công thức (1e) cũng có thể được điều chế bằng phản ứng chuyển vị hợp chất có công thức (17) bằng cách xử lý với bazơ như được thể hiện trong sơ đồ 10 (ví dụ, xem *J. Het Chem* 1970, 7 page 1019). Hợp chất có công thức (17) có thể được điều chế bằng phương pháp mô tả trong WO2008006540 và *J. Org. Chem.*, 1966, p,251.

Sơ đồ 10



Hợp chất trung gian có công thức (18) có thể được điều chế bằng phương pháp được thể hiện trong sơ đồ 11 bằng cách xử lý 2-aminopyridin có công thức (15) với isoxyanat, sau đó bằng hydroxylamin và bazơ thích hợp, như triethylamin.

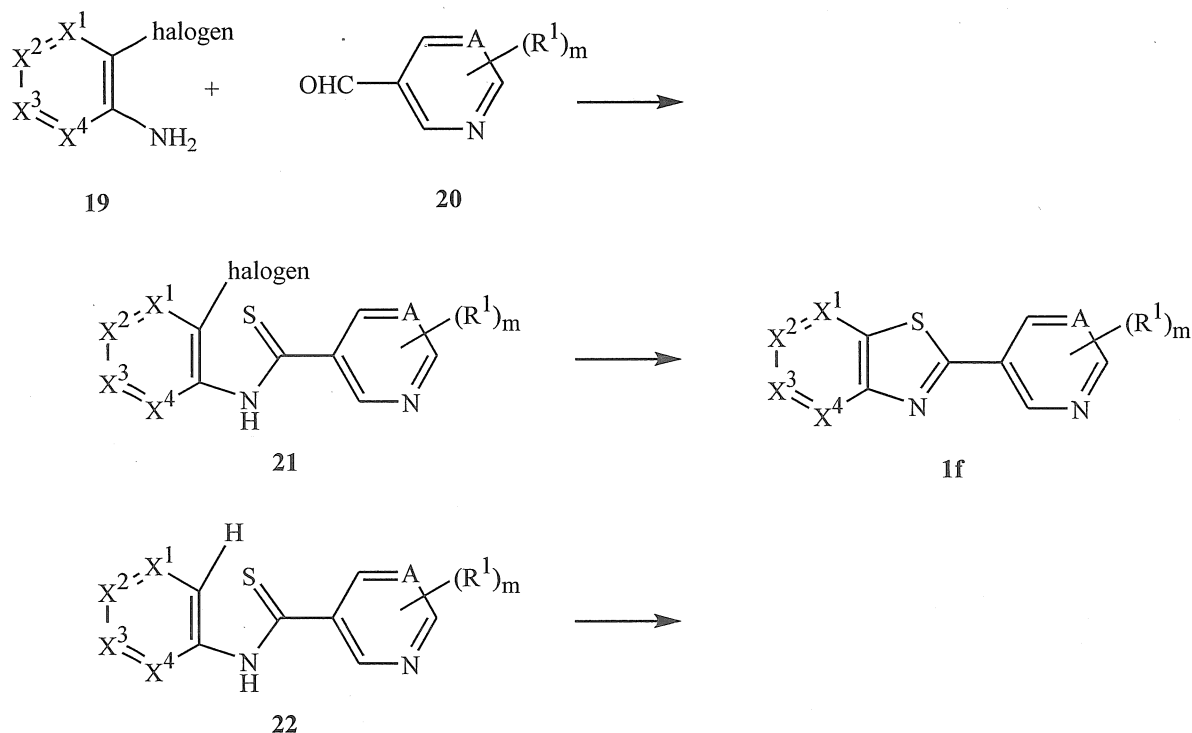
Sơ đồ 11



Hợp chất có công thức (1f) có thể được điều chế theo sơ đồ 12 bằng phản ứng oxy hóa đóng vòng aryl aldehyt có công thức (20) với anilin có công thức (19) chứa nhóm thế halogen ở vị trí ortho, tốt hơn nếu iot, trong sự có mặt của lưu huỳnh đóng vai trò làm nguồn lưu huỳnh lẫn chất oxy hóa. Phản ứng này được thực hiện trong sự có mặt của

bazơ, như K_2CO_3 trong dung môi thích hợp, như nước hoặc DMF, và được xúc tác bằng cách bổ sung muối đồng (ví dụ, CuI hoặc $CuCl_2$) và tốt hơn nếu phối tử thích hợp, như 1,10-phenanthroline. Nhiệt độ phản ứng thông thường nằm trong khoảng từ $70^\circ C$ đến nhiệt độ sôi của dung môi.

Sơ đồ 12



Hợp chất có công thức (1f) cũng có thể được điều chế bằng phản ứng đóng vòng 2-halothioamit có công thức (21) như được thể hiện trong phản ứng thứ hai của sơ đồ 12 với bazơ, như K^tBu, NaH, DBU hoặc Cs_2CO_3 trong dung môi thích hợp, như toluen hoặc DMF, tùy ý có bổ sung muối đồng, như CuI, và tốt hơn nếu phối tử thích hợp, như 1,10-phenanthroline. Phản ứng này cũng có thể được xúc tác bằng hợp chất Pd, như hợp chất được điều chế từ $Pd_2(dba)_3$ và $(t-Bu)_2P-o$ -biphenyl, bazơ, như Cs_2CO_3 trong dung môi thích hợp, như 1,2-dimethoxyetan hoặc đioxan. Nhiệt độ phản ứng thông thường nằm trong khoảng từ $80^\circ C$ đến nhiệt độ sôi của dung môi. Đối với các phản ứng được xúc tác bằng đồng và Pd, tốt hơn nếu phần tử thế halogen trên hợp chất có công thức (21) là Br hoặc I. Ví dụ, xem *Journal of Organic Chemistry* 2006, 71(5), pp. 1802-1808; *Tetrahedron Letters* 2003, 44(32), pp. 6073-6077; *Synthetic Communications* 1991, 21(5), pp. 625-33; và Eur. Pat. Appl. No. 450420.

Hợp chất có công thức (1f) cũng có thể được điều chế bằng phản ứng đóng vòng oxy hóa thioamit có công thức (22) như được thể hiện trong phản ứng thứ ba của sơ đồ

12. Các chất oxy hóa thường được sử dụng trong phương pháp này bao gồm brom hoặc iot, DDQ và $K_3Fe(CN)_6$. Ví dụ, xem *Tetrahedron* 2007, 63(41), pp. 10276-10281; *Synthesis* 2007, (6), 819-823; và Đơn công bố Patent Mỹ số 20120215154.

Ba phương pháp được mô tả trong sơ đồ 12 có thể được sử dụng để điều chế hợp chất, trong đó X^1-X^4 là nguyên tử cacbon, hoặc một trong số các nhóm X^1-X^4 là nitơ (Ví dụ, xem *J. Dị vòng Chem.* 2009, 46, p.1125 và các tài liệu tham khảo được viện dẫn trong tài liệu này).

Hợp chất có công thức (1), và hợp chất trung gian được sử dụng trong điều chế hợp chất có công thức (1), trong đó Z là S có thể được điều chế bằng phản ứng lưu huỳnh hóa hợp chất tương ứng, trong đó Z là O với chất phản ứng Lawesson (mã CAS số 19172-47-5), chất phản ứng Belleau (mã CAS số 88816-02-8) hoặc P_2S_5 . Phản ứng lưu huỳnh hóa này thường được thực hiện trong dung môi, như toluen, xylen hoặc đioxan, và ở nhiệt độ cao nằm trong khoảng từ 80°C đến nhiệt độ sôi của dung môi.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này hiểu rằng một số chất phản ứng và điều kiện phản ứng nêu trên để điều chế hợp chất có công thức (1) có thể không tương thích với một số chức năng nhất định có trong hợp chất trung gian. Trong các trường hợp này, việc kết hợp các phản ứng bảo vệ/khử bảo vệ hoặc biến đổi các nhóm chức vào phương pháp tổng hợp sẽ hỗ trợ việc thu được hợp chất mong muốn. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ dễ dàng sử dụng và chọn được nhóm bảo vệ thích hợp (ví dụ, xem Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Trong một số trường hợp, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng sau khi nạp các chất phản ứng được mô tả trong các sơ đồ riêng biệt, bước tổng hợp bổ sung không được mô tả chi tiết có thể cần thiết để tổng hợp được hợp chất có công thức (1). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng sẽ nhận ra rằng có thể cần kết hợp các bước được mô tả trong các sơ đồ nêu trên theo thứ tự khác với thứ tự được mô tả trong trình tự cụ thể để điều chế hợp chất có công thức (1).

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng sẽ nhận ra rằng hợp chất có công thức (1) và hợp chất trung gian mô tả trong sáng chế có thể được đưa vào các phản ứng ái điện tử, phản ứng ái nhân, phản ứng gốc, phản ứng cơ kim, phản ứng oxy hóa, và phản ứng khử để bổ sung các phân tử thế hoặc cải biến các phân tử thế đang tồn tại.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này hiểu rằng bằng cách sử dụng phần mô tả nêu trên có thể thực hiện đầy đủ sáng chế. Do đó, các ví dụ điều chế sau chỉ nhằm mục đích minh họa chứ không giới hạn phạm vi của sáng chế. Các bước trong các ví dụ điều chế sau thể hiện quy trình trong bước trong toàn bộ phương pháp tổng hợp, và các hợp chất ban đầu trong mỗi bước không nhất thiết phải được điều chế bằng quy trình cụ thể được mô tả trong các bước hoặc ví dụ còn lại. Tỷ lệ phần trăm là tỷ lệ phần trăm khối lượng, ngoại trừ đối với hỗn hợp dung môi dùng để phân tích sắc ký hoặc trừ khi có quy định khác. Phần và tỷ lệ phần trăm của hỗn hợp dung môi dùng để phân tích sắc ký là tỷ lệ phần trăm thể tích trừ khi có quy định khác. Phổ ^1H NMR được ghi ở nồng độ ppm ở từ trường thấp từ tetrametylsilan; “s” là vạch đơn, “d” là vạch đôi, “t” là vạch ba, “q” là vạch bốn, “m” là nhiều vạch, “dd” là vạch đôi của vạch đôi, “dt” là vạch đôi của vạch ba, “br s” là vạch đơn rộng. DMF là *N,N*-dimetylformamit. Hợp chất được đánh số theo Bảng chỉ số A.

Ví dụ điều chế 1

Điều chế 1-[2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-yl]etanon (hợp chất 5)

Bước A: Điều chế 1-[2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-yl]etanon

Dung dịch chứa 4-bromo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol (2g, 7,3mmol), *n*-butyl vinyl ete (1,8mL, 14,6mmol), paladi axetat (163mg, 0,73mmol), DPPP (601mg, 1,46mmol), và K_2CO_3 (1,2g, 8,7mmol) trong DMF đã được đuổi khí (40mL) và nước (10mL) được gia nhiệt đến nhiệt độ 100°C trong 2 giờ trong điều kiện khí nitơ. Sau khi làm nguội đến nhiệt độ phòng, hỗn hợp phản ứng được xử lý với dung dịch nước HCl 1N (20mL) và khuấy trong 15 phút. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được pha loãng với EtOAc (100mL) và các lớp được phân tách. Lớp nước được chiết bằng EtOAc (2 x 100mL), và các lớp hữu cơ thu gom được rửa bằng nước (3 x 50mL), sau đó bằng nước muối (50mL). Pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô trong điều kiện chân không. Hợp chất thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột pha thuận (silic oxit gel, 0-100% EtOAc trong hexan) để thu được hợp chất mong muốn (0,98g) dưới dạng chất rắn màu trắng nhạt. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 9,28 (m, 1H), 9,23 (d, $J=0,95$ Hz, 1H), 8,69 (m, 1H), 8,31 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 2,72 (s, 3H).

Ví dụ điều chế 2

Điều chế *N*-(1-metyletyl)-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetamit (hợp chất 38)

Bước A: Điều chế dimetyl 2-[2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-yl]propandioat

Dimetyl malonat (0,83mL, 7,3mmol), 5-bromo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol (1,0g, 3,65mmol) và kali phosphat (1,9mg, 9,12mmol) được hòa tan trong đioxan khan (20mL) trong điều kiện khí nitơ, và hỗn hợp phản ứng được đuổi khí trong 10 phút. Paladi(II) axetat (33mg, 0,146mmol) và 9,9-dimetyl-4,5-bis(diphenylphosphino)-xanthen (170mg, 0,292mmol) được bổ sung vào, và hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt đến nhiệt độ hồi lưu qua đêm. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm nguội, lọc qua Celite®, và chất rắn đã được lọc được rửa bằng EtOAc. Các dịch lọc hữu cơ thu gom được được cô trong điều kiện áp suất giảm, và hợp chất thô được tinh chế bằng phương pháp sắc ký cột pha thuận (silic oxit gel được rửa giải bằng 20-60% EtOAc trong hexan) để thu được hợp chất mong muốn (0,78g) dưới dạng chất rắn màu trắng. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9,17 (d, *J*=2,45 Hz, 1H), 8,67 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,23-8,31 (m, 1H), 7,73-7,85 (m, 2H), 7,46-7,55 (m, 1H), 7,37-7,44 (m, 1H), 4,75 (s, 1H), 3,79 (s, 6H).

Bước B: Điều chế axit 2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetic

Hỗn dịch chứa dimetyl 2-[2-(3-pyridyl)-2*H*-indazol-5-yl]propandioat (0,7g, 2,15mmol) trong hỗn hợp chứa nước NaOH 1N (20mL) và MeOH (20mL) được gia nhiệt đến nhiệt độ hồi lưu trong 3 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm nguội, metanol được làm bay hơi, và hỗn hợp phản ứng được axit hóa bằng HCl 3M đến pH 3-4. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được gia nhiệt đến nhiệt độ hồi lưu trong 3 giờ. Sau khi làm nguội, hợp chất kết tủa được phân lập bằng cách lọc, rửa bằng nước, và làm khô để thu được hợp chất mong muốn (0,37g) dưới dạng chất rắn màu trắng. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9,28-9,36 (m, 1 H), 9,10-9,17 (m, 1H), 8,61-8,68 (m, 1H), 8,43-8,51 (m, 1H), 7,59-7,72 (m, 3H), 7,21-7,29 (m, 1H), 3,64 (d, *J*=12,72 Hz, 2H).

Bước C: Điều chế *N*-(1-metyletyl)-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetamit

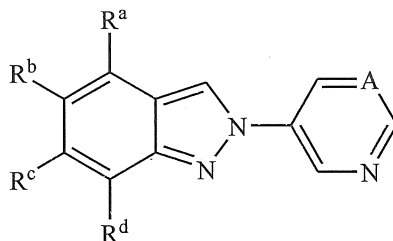
Propylphosphonic anhydrit (T₃P®) (1,7mL, 2,84mmol, 50% khối lượng trong EtOAc) được bổ sung vào dung dịch được khuấy chứa axit 2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetic (360mg, 1,42mmol), isopropyl amin (250μL, 2,84mmol) và trietylamin (395μL, 2,84mmol) trong diclometan khan (10mL) trong điều kiện khí nitơ. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng qua đêm. Diclometan (20mL) được bổ sung vào, hỗn hợp phản ứng được rửa bằng nước, và pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat. Pha hữu cơ được làm bay hơi trong điều kiện áp suất giảm để thu được chất rắn, sau đó chất rắn này

được nghiền với ete/hexan theo tỷ lệ 1:1. Chất rắn được phân lập bằng cách lọc và tiếp tục rửa bằng ete/hexan theo tỷ lệ 1:1 để thu được hợp chất mong muốn (0,37g) dưới dạng chất rắn màu trắng. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 9,21 (d, $J=2,45$ Hz, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,59 (dd, $J=4,65, 1,22$ Hz, 1H), 8,40 (d, $J=1,47$ Hz, 1H), 7,93-8,04 (m, 1H), 7,58-7,68 (m, 3H), 7,25-7,32 (m, 1H), 3,91-4,04 (m, 1H), 3,54 (s, 2H), 1,15 (d, $J=6,36$ Hz, 6H).

Hợp chất có công thức (1), được điều chế bằng các phương pháp và biến thể của chúng như được mô tả trong sơ đồ 1-12 và ví dụ điều chế 1 và 2, được thể hiện trong Bảng chỉ số sau.

Các ký hiệu viết tắt được sử dụng trong Bảng chỉ số có thể bao gồm: *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 *bậc ba*-butyl, Ph là phenyl, OMe là metoxy, SMe là methylthio, và SO_2Me là metylsulfonyl. Đường lượn sóng hoặc “-” trong góc có công thức cấu tạo cụ thể thể hiện vị trí gắn của gốc này vào phần còn lại của phân tử.

Bảng chỉ số A



R^b , R^c và R^d là H

Hợp chất	R^a	A	Khối phổ	Nhiệt độ nóng chảy
1	$-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{Me})\text{OMe}$	CH	311,3	
2	$-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	CH	298,2	
3	$-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$	CH	314,2	
4	$-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	CH	330,2	
5	$-\text{C}(\text{O})\text{Me}$	CH	238,2	
6	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{isopropyl})$	CH	295,3	
7	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2(2\text{-pyrimidinyl})$	CH	345,3	
8	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHC}(\text{Me})_2\text{CN5}$	CH	320,3	
9	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	CH	335,3	
10	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHNHC}(\text{O})\text{OMe}$	CH	326,3	
11	phenoxy	CH		121-124
12	2-clo-4-pyridinyloxy	CH		170-174
13	2-pyrazinyloxy	CH		145-148
14	2-pyridinyloxy	CH		138-142
15	2-flo-4-pyridinyloxy	CH		142-146
16	$-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{NHNHC}(\text{O})\text{OMe}$	CH	340,3	

17	2-pyrimidinylloxy	CH		208-211
18	-OCH ₂ CH(Me) ₂	CH		119-122
19	-OPr	CH		107-111
20	-OCH ₂ (xyclopropyl)	CH		114-118
21	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NHMe	CH	352,3	
22	-C(O)C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NHMe	CH	366,3	
23	-OCH ₂ C(Me) ₂ C(O)NEt	CH		150-153
24	-OCH ₂ C(Me) ₂ C(O)NMe ₂	CH		158-162
25	-OCH ₂ C(Me) ₂ C(O)OMe	CH		101-105
26	-OCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH		117-121
27	-OEt	CH		114-117
28	-OCH ₂ C(Me) ₂ CN	CH		136-141

R^a, R^c và R^d là H

Hợp chất	R ^b	A	Khối phổ	Nhiệt độ nóng chảy
30	-C(O)Me	CH	238,5	
31	-C(O)CH ₂ CH ₂ SMe	CH	298,2	
32	-C(O)CH ₂ CH ₂ N(Me)OMe	CH	311,2	
33	-C(O)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH	314,2	
34	-C(O)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH	330,1	
35	4-(triflometyl)phenoxy	CH		
36	phenoxy	CH		
37	-C(O)CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH		
38	-CH ₂ C(O)NH(isopropyl)	CH	295,3	
39	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ (2-pyrimidinyl)	CH	345,3	
40	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CN	CH	320,3	
41	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	335,3	
42	2-pyrimidinylloxy	CH		200-203
43	4-pyrimidinylloxy	CH		201-204
44	2-pyrazinylloxy	CH		174-176
45	2-(triflometyl)-4-pyridinylloxy	CH		141-145
46	2-pyridinylloxy	CH		100-104
47	-C(O)C(O)NH(isopropyl)	CH	309,3	
48	-C(O)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	349,3	
49	-CH(OH)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	351,3	
50	-CH(OH)C(O)NH(isopropyl)	CH	311,3	
51	-CH(Me)C(O)NH(isopropyl)	CH	309,4	
52	-OEt	CH		148-152
53	-OCH ₂ (xyclopropyl)	CH		115-119
54	-OCH ₂ CH(Me) ₂	CH		110-114
55	-OPr	CH		111-115
56	-CH ₂ C(O)NH(isopropyl)	CF	313,4	
57	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NHMe	CH	352,4	
58	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)	CH	337,3	
59	-CH(Me)C(O)NHCH ₂ (2-pyrimidinyl)	CH	359,4	
60	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)	CF	355,4	
61	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	341,4	
62	-CH ₂ C(O)NHS(O) ₂ NMe ₂	CH	360,3	
63	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NEt	CH	366,4	
64	-OCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH		119-123
65	-OCH ₂ (2-oxetanyl)	CH		137-141
66	-OCH ₂ (2-oxiranyl)	CH		113-117
67	-CH=CHC(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH		111-115
68	-OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH		95-98

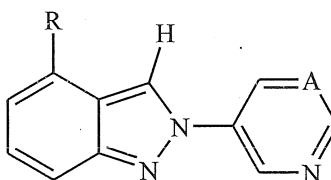
69	-OCH ₂ CH ₂ C(O)NMe ₂	CH		160-163
70	-CH=CHC(O)NH(isopropyl)	CH		220-224
71	-CH=CHC(O)NH(xyclopropyl)	CH		131-135
72	-OCH ₂ CH ₂ C(O)NHEt	CH		158-161
73	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ C(O)OMe	CH	353,4	
74	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NHMe	CF	370,4	
75	-C(O)C(O)NHC(Me) ₂ C(O)OMe	CH	367,4	
76	-CH(OH)C(O)NHC(Me) ₂ C(O)OMe	CH	369,4	
77	-C(O)C(O)NHC(Me) ₂ C(O)NHMe	CH	384,3	
78	-CH ₂ CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH		130-133
79	-CH ₂ CH ₂ C(O)NH(isopropyl)	CH		177-181
80	-CH ₂ CH ₂ C(O)NH(xyclopropyl)	CH		181-185
81	-CH ₂ CH ₂ C(O)NHCH ₂ (2-pyrimidinyl)	CH		110-113
82	-CH=CHC(O)NHCH ₂ (2-pyrimidinyl)	CH		237-241
83	3-(triflometyl)phenoxy	CH		
84	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ (2-pyrimidinyl)	CF	363,4	
85	-CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CN	CH	334,4	

R^c và R^d là H

Hợp chất	R ^a	R ^b	A	Nhiệt độ nóng chảy
86	F	-CH ₂ C(O)NH(isopropyl)	CH	209-213
87	F	-CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CN	CH	200-203
88	F	-CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	164-168

Ví dụ về hợp chất trung gian hữu ích trong điều chế hợp chất theo sáng chế được thể hiện trong Bảng I-1 đến I-16. Các ký hiệu viết tắt sau được sử dụng trong các Bảng này bao gồm: Me là metyl, Et là etyl, Ph là phenyl, C(O) là carbonyl và CHO là formyl.

Bảng I-1



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

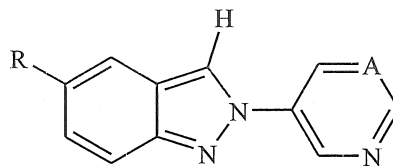
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

Bảng I-2



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

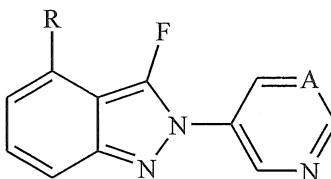
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

Bảng I-3



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

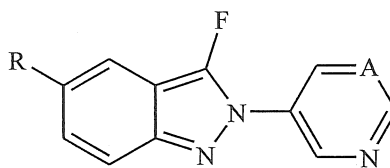
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

A là N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

Bảng I-4



A là CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

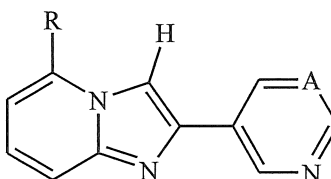
A là CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

A là N

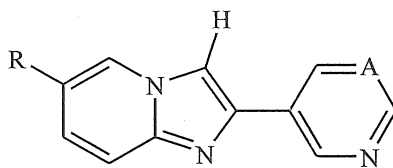
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	xyano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrophenyl)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	OH

Bảng I-5



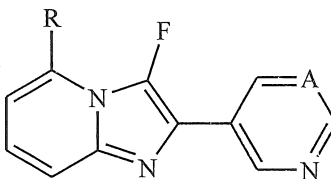
Bảng I-5 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-6



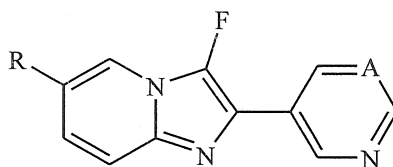
Bảng I-6 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-7



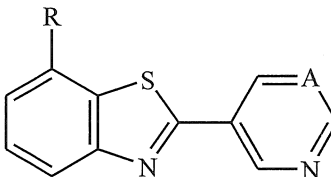
Bảng I-7 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-8



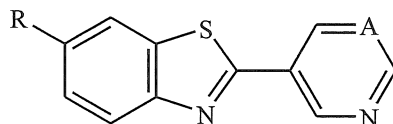
Bảng I-8 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-9



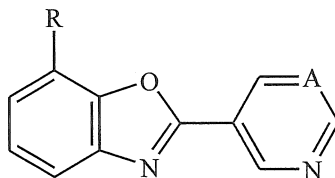
Bảng I-9 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-10



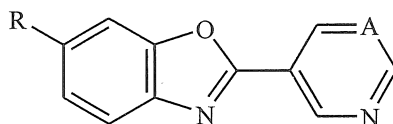
Bảng I-10 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-11



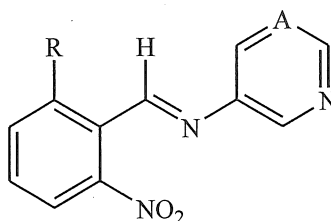
Bảng I-11 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-12



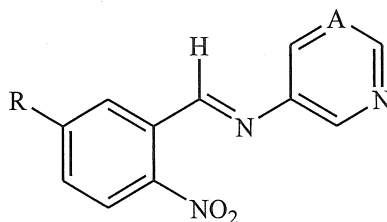
Bảng I-12 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-13



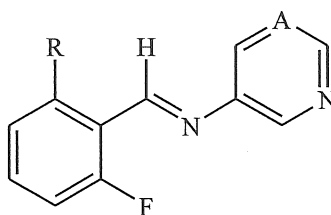
Bảng I-13 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-14



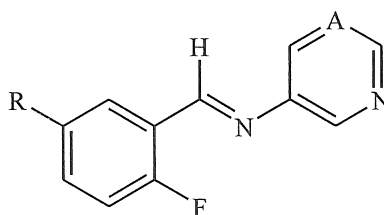
Bảng I-14 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng I-15



Bảng I-15 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

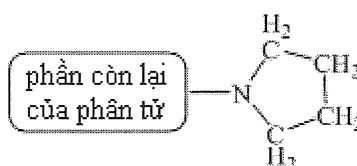
Bảng I-16



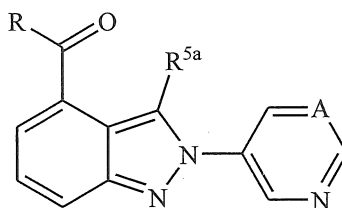
Bảng I-16 là giống hệt với Bảng I-1, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng I-1” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Các hợp chất được thể hiện trong Bảng 1 đến 28g có thể được điều chế theo các phương pháp theo sáng chế và các phương pháp đã biết trong lĩnh vực này. Các ký hiệu viết tắt có thể được sử dụng trong các bảng này bao gồm: *t* là bậc ba, *s* là bậc hai, *i* là iso, *c* là xyclo, Me là metyl, Et là etyl, Pr là propyl, Bu là butyl, Ph là phenyl, OMe là metoxy, OEt là etoxy, SMe là methylthio, SEt là etylthio, -CN là xyano, Ph là phenyl, Py là pyridinyl, -NO₂ là nitro, S(O)Me là metylsulfinyl, và S(O)₂Me là metylsulfonyl.

Ký hiệu “-” ở vị trí đầu tiên của gốc thể hiện vị trí gắn gốc này vào phần còn lại của phân tử; ví dụ, “-CH₂CH₂OMe” thể hiện gốc 2-metoxyletyl. Các gốc mạch vòng được thể hiện bằng cách sử dụng hai ký hiệu “-” trong dấu ngoặc đơn; ví dụ, gốc 1-pyrrolidinyl được thể hiện bằng “N(-CH₂CH₂CH₂CH₂-)”, trong đó nguyên tử được liên kết với cả hai nguyên tử cacbon tận cùng của mạch chứa bốn nguyên tử cacbon, như được thể hiện dưới đây.



Bảng 1a

A là CH; R^{5a} là H

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-methylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxylobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxypropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl

Bảng 1b

Bảng 1b là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là A là CF.

Bảng 1c

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

Bảng 1d

Bảng 1d là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là R^{5a} là F.

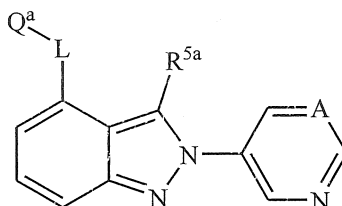
Bảng 1e

Bảng 1e là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 1f

Bảng 1f là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là R^{5a} là F và A là N.

Bảng 2a-1



L là O; A là CH; R^{5a} là H

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxo-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxo-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxo-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxo-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxo-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxo-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl

3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 2b-1

Bảng 2b-1 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF.

Bảng 2c-1

Bảng 2c-1 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N.

Bảng 2d-1

Bảng 2d-1 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F.

Bảng 2e-1

Bảng 2e-1 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 2f-1

Bảng 2f-1 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và A là N.

Bảng 2a-2

Bảng 2a-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là S.

Bảng 2b-2

Bảng 2b-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là S.

Bảng 2c-2

Bảng 2c-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là S.

Bảng 2d-2

Bảng 2d-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là S.

Bảng 2e-2

Bảng 2e-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là S.

Bảng 2f-2

Bảng 2f-2 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là S.

Bảng 2a-3

Bảng 2a-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 2b-3

Bảng 2b-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là S(O).

Bảng 2c-3

Bảng 2c-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là S(O).

Bảng 2d-3

Bảng 2d-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là S(O).

Bảng 2e-3

Bảng 2e-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là S(O).

Bảng 2f-3

Bảng 2f-3 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là S(O).

Bảng 2a-4

Bảng 2a-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là SO_2 .

Bảng 2b-4

Bảng 2b-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là SO₂.

Bảng 2c-4

Bảng 2c-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là SO₂.

Bảng 2d-4

Bảng 2d-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là SO₂.

Bảng 2e-4

Bảng 2e-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là SO₂.

Bảng 2f-4

Bảng 2f-4 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là SO₂.

Bảng 2a-5

Bảng 2a-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là NH.

Bảng 2b-5

Bảng 2b-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là NH.

Bảng 2c-5

Bảng 2c-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là NH.

Bảng 2d-5

Bảng 2d-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là NH.

Bảng 2e-5

Bảng 2e-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là NH.

Bảng 2f-5

Bảng 2f-5 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là NH.

Bảng 2a-6

Bảng 2a-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 2b-6

Bảng 2b-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là NMe.

Bảng 2c-6

Bảng 2c-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là NMe.

Bảng 2d-6

Bảng 2d-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là NMe.

Bảng 2e-6

Bảng 2e-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là NMe.

Bảng 2f-6

Bảng 2f-6 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là NMe.

Bảng 2a-7

Bảng 2a-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là L là C(O).

Bảng 2b-7

Bảng 2b-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là CF và L là C(O).

Bảng 2c-7

Bảng 2c-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là A là N và L là C(O).

Bảng 2d-7

Bảng 2d-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là C(O).

Bảng 2e-7

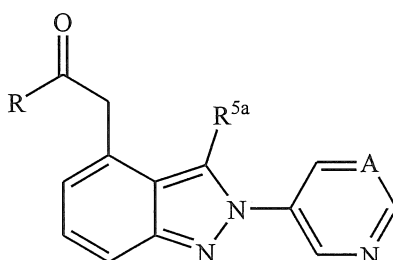
Bảng 2e-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là C(O).

Bảng 2f-7

Bảng 2f-7 là giống hệt với Bảng 2a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là C(O).

Bảng 3a, 3b, 3c, 3d, 3e và 3f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 3a, 3b, 3c, 3d, 3e và 3f:



Bảng 3a là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 3b là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

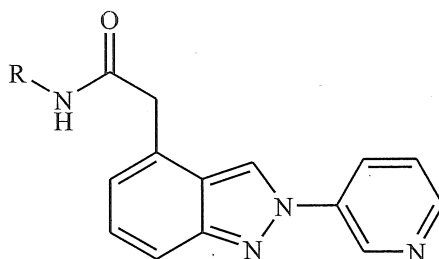
Bảng 3c là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 3d là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 3e là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

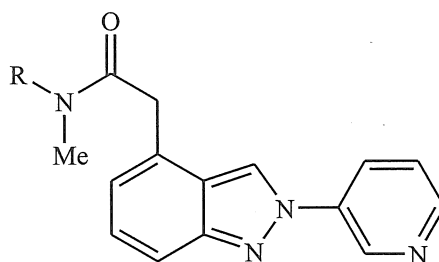
Bảng 3f là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 3g



Bảng 3g là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

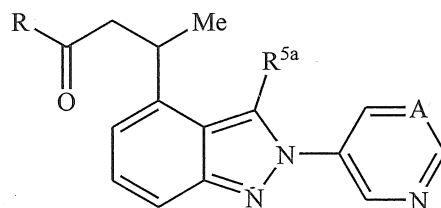
Bảng 3h



Bảng 3h là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 4a, 4b, 4c, 4d, 4e và 4f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 4a, 4b, 4c, 4d, 4e và 4f:



Bảng 4a là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 4b là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

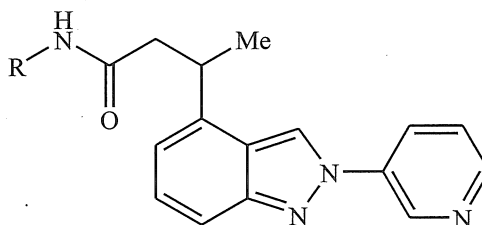
Bảng 4c là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 4d là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 4e là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

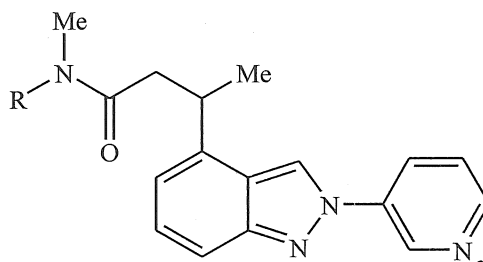
Bảng 4f là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 4g



Bảng 4g là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

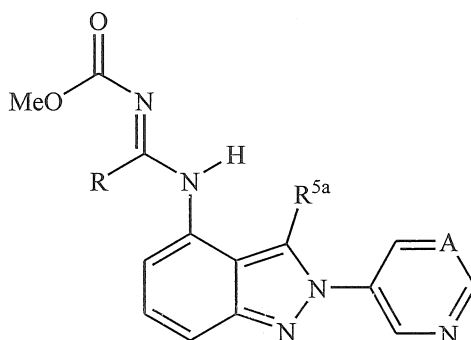
Bảng 4h



Bảng 4h là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 5a, 5b, 5c, 5d, 5e và 5f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 5a, 5b, 5c, 5d, 5e và 5f:



Bảng 5a là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 5b là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

Bảng 5c là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

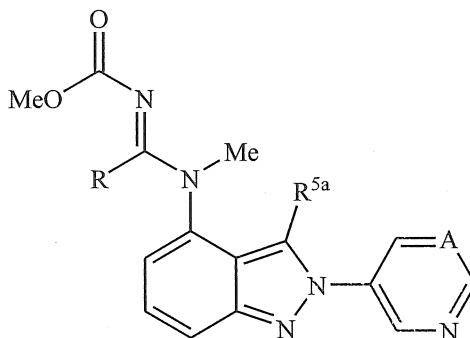
Bảng 5d là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 5e là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 5f là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 6a, 6b, 6c, 6d, 6e và 6f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 6a, 6b, 6c, 6d, 6e và 6f:



Bảng 6a là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 6b là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

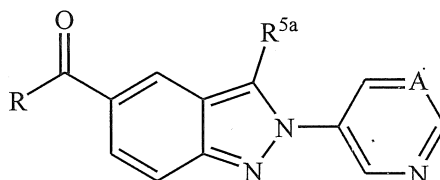
Bảng 6c là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 6d là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 6e là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 6f là giống hệt với Bảng 1a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 1a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 7a



A là CH; R^{5a} là H

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu

t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-methylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxycyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 7b

Bảng 7b là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là A là CF.

Bảng 7c

Bảng 7c là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là A là N.

Bảng 7d

Bảng 7d là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là R^{5a} là F.

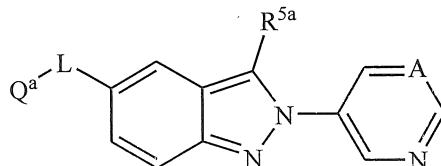
Bảng 7e

Bảng 7e là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 7f

Bảng 7f là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là R^{5a} là F và A là N.

Bảng 8a-1



L là O; A là CH; R^{5a} là H

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxi-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxi-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxi-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxi-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxi-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxi-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxi-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxi-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxi-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxi-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxi-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxi-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxi-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxi-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxi-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxi-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxi-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxi-4-pyrimidinyl

6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 8b-1

Bảng 8b-1 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF.

Bảng 8c-1

Bảng 8c-1 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N.

Bảng 8d-1

Bảng 8d-1 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F.

Bảng 8e-1

Bảng 8e-1 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 8f-1

Bảng 8f-1 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và A là N.

Bảng 8a-2

Bảng 8a-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là S.

Bảng 8b-2

Bảng 8b-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là S.

Bảng 8c-2

Bảng 8c-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là S.

Bảng 8d-2

Bảng 8d-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là S.

Bảng 8e-2

Bảng 8e-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là S.

Bảng 8f-2

Bảng 8f-2 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là S.

Bảng 8a-3

Bảng 8a-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 8b-3

Bảng 8b-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là S(O).

Bảng 8c-3

Bảng 8c-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là S(O).

Bảng 8d-3

Bảng 8d-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là S(O).

Bảng 8e-3

Bảng 8e-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là S(O).

Bảng 8f-3

Bảng 8f-3 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là S(O).

Bảng 8a-4

Bảng 8a-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 8b-4

Bảng 8b-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là SO₂.

Bảng 8c-4

Bảng 8c-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là SO₂.

Bảng 8d-4

Bảng 8d-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là SO₂.

Bảng 8e-4

Bảng 8e-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là SO₂.

Bảng 8f-4

Bảng 8f-4 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là SO_2 .

Bảng 8a-5

Bảng 8a-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là NH.

Bảng 8b-5

Bảng 8b-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là NH.

Bảng 8c-5

Bảng 8c-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là NH.

Bảng 8d-5

Bảng 8d-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là NH.

Bảng 8e-5

Bảng 8e-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là NH.

Bảng 8f-5

Bảng 8f-5 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là NH.

Bảng 8a-6

Bảng 8a-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 8b-6

Bảng 8b-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là NMe.

Bảng 8c-6

Bảng 8c-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là NMe.

Bảng 8d-6

Bảng 8d-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là NMe.

Bảng 8e-6

Bảng 8e-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là NMe.

Bảng 8f-6

Bảng 8f-6 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là NMe.

Bảng 8a-7

Bảng 8a-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là L là C(O).

Bảng 8b-7

Bảng 8b-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là CF và L là C(O).

Bảng 8c-7

Bảng 8c-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là A là N và L là C(O).

Bảng 8d-7

Bảng 8d-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F và L là C(O).

Bảng 8e-7

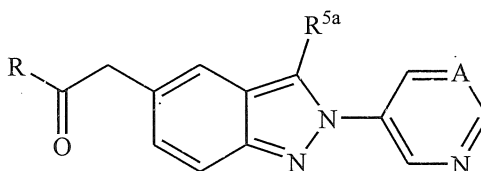
Bảng 8e-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là CF và L là C(O).

Bảng 8f-7

Bảng 8f-7 là giống hệt với Bảng 8a-1, chỉ khác là R^{5a} là F, A là N và L là C(O).

Bảng 9a, 9b, 9c, 9d, 9e và 9f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 9a, 9b, 9c, 9d, 9e và 9f:



Bảng 9a là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 9b là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

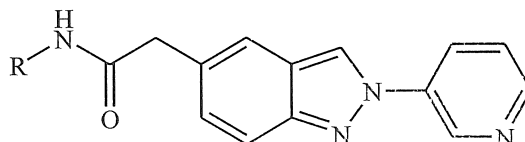
Bảng 9c là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 9d là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 9e là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

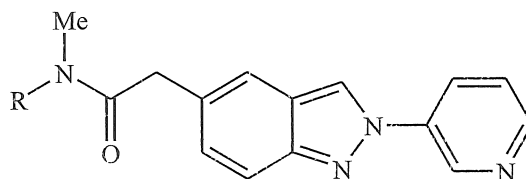
Bảng 9f là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 9g



Bảng 9g là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

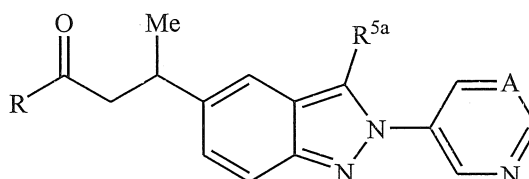
Bảng 9h



Bảng 9h là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 10a, 10b, 10c, 10d, 10e và 10f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 10a, 10b, 10c, 10d, 10e và 10f:



Bảng 10a là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 10b là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

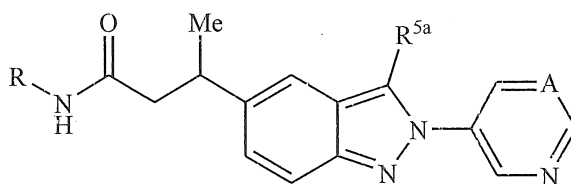
Bảng 10c là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 10d là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 10e là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

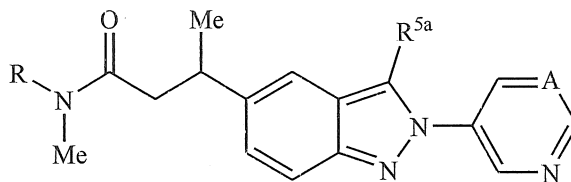
Bảng 10f là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 10g



Bảng 10g là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

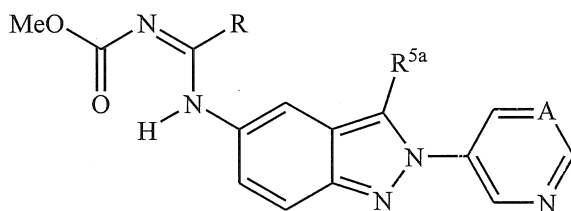
Bảng 10h



Bảng 10h là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 11a, 11b, 11c, 11d, 11e và 11f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 11a, 11b, 11c, 11d, 11e và 11f:



Bảng 11a là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 11b là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

Bảng 11c là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

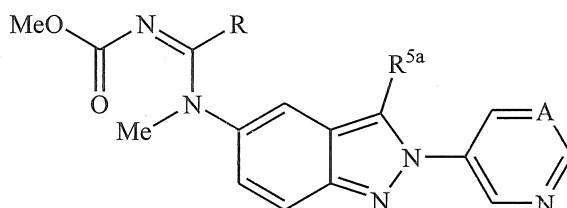
Bảng 11d là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 11e là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 11f là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

Bảng 12a, 12b, 12c, 12d, 12e và 12f

Công thức cấu tạo sau liên quan đến Bảng 12a, 12b, 12c, 12d, 12e và 12f:



Bảng 12a là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên.

Bảng 12b là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là CF.

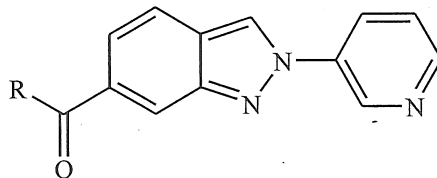
Bảng 12c là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và A là N.

Bảng 12d là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F.

Bảng 12e là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là CF.

Bảng 12f là giống hệt với Bảng 7a, chỉ khác là công thức cấu tạo được thể hiện dưới tiêu đề “Bảng 7a” được thay bằng công thức cấu tạo nêu trên, và R^{5a} là F và A là N.

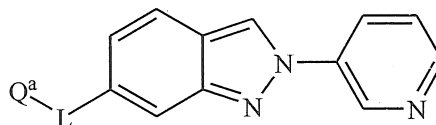
Bảng 13



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-methylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl

		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
--	--	--

Bảng 14a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxi-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxi-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxi-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxi-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxi-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxi-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxi-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxi-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxi-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxi-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxi-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxi-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxi-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxi-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxi-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxi-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxi-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxi-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxi-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxi-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxi-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxi-1,2,3-triazin-2-yl

4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 14b

Bảng 14b là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là S.

Bảng 14c

Bảng 14c là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 14d

Bảng 14d là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 14e

Bảng 14e là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là NH.

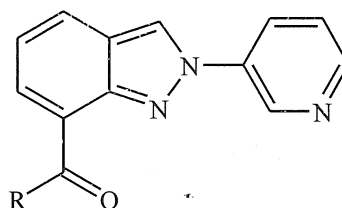
Bảng 14f

Bảng 14f là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 14g

Bảng 14g là giống hệt với Bảng 14a, chỉ khác là L là C(O).

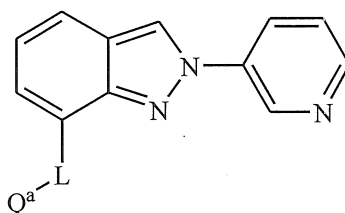
Bảng 15



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt

-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-methylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxycyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 16a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxo-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxo-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxo-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxo-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl

2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxo-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxo-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 16b

Bảng 16b là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là S.

Bảng 16c

Bảng 16c là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 16d

Bảng 16d là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 16e

Bảng 16e là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là NH.

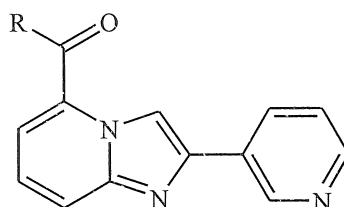
Bảng 16f

Bảng 16f là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 16g

Bảng 16g là giống hệt với Bảng 16a, chỉ khác là L là C(O).

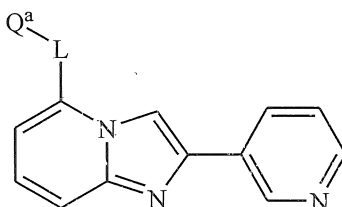
Bảng 17



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metylcyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxycyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂

-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxo-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxo-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 18a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxo-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxo-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxo-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxo-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxo-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxo-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl

4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 18b

Bảng 18b là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là S.

Bảng 18c

Bảng 18c là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 18d

Bảng 18d là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là SO².

Bảng 18e

Bảng 18e là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là NH.

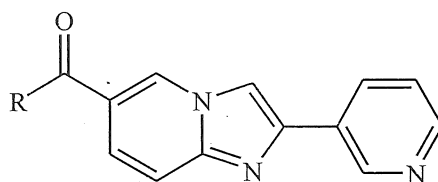
Bảng 18f

Bảng 18f là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 18g

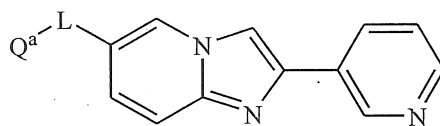
Bảng 18g là giống hệt với Bảng 18a, chỉ khác là L là C(O).

Bảng 19



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 20a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxo-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxo-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxo-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxo-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxo-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxo-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl

2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 20b

Bảng 20b là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là S.

Bảng 20c

Bảng 20c là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 20d

Bảng 20d là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 20e

Bảng 20e là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là NH.

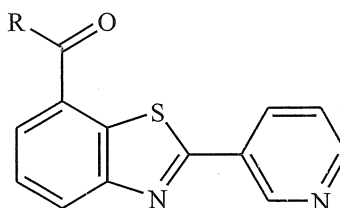
Bảng 20f

Bảng 20f là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 20g

Bảng 20g là giống hệt với Bảng 20a, chỉ khác là L là C(O).

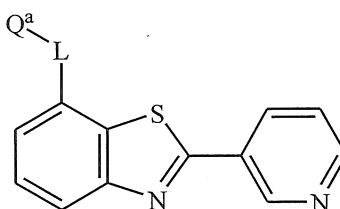
Bảng 21



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et

-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-methylcyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 22a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxi-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxi-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxi-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxi-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxi-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxi-3-pyridinyl

4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 22b

Bảng 22b là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là S.

Bảng 22c

Bảng 22c là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 22d

Bảng 22d là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 22e

Bảng 22e là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là NH.

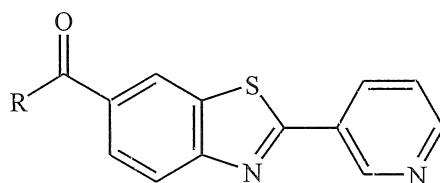
Bảng 22f

Bảng 22f là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 22g

Bảng 22g là giống hệt với Bảng 22a, chỉ khác là L là C(O).

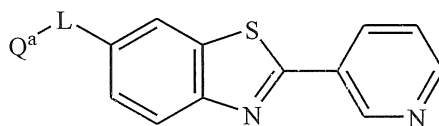
Bảng 23



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metylcyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxycyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)

-CH ₂ (3-methoxy-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-methoxy-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-methoxy-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-methoxy-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-methoxy-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-methyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 24a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-methyl-2-pyridinyl	3-methoxy-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-methyl-2-pyridinyl	4-methoxy-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-methyl-2-pyridinyl	5-methoxy-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-methyl-2-pyridinyl	6-methoxy-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-methyl-3-pyridinyl	2-methoxy-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-methyl-3-pyridinyl	4-methoxy-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-methyl-3-pyridinyl	5-methoxy-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-methyl-3-pyridinyl	6-methoxy-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-methyl-4-pyridinyl	2-methoxy-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-methyl-4-pyridinyl	3-methoxy-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-methyl-2-pyrazinyl	3-methoxy-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-methyl-2-pyrazinyl	5-methoxy-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-methyl-2-pyrazinyl	6-methoxy-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-methyl-2-pyrimidinyl	4-methoxy-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-methyl-2-pyrimidinyl	5-methoxy-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-methyl-4-pyrimidinyl	2-methoxy-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-methyl-4-pyrimidinyl	5-methoxy-4-pyrimidinyl

5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 24b

Bảng 24b là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là S.

Bảng 24c

Bảng 24c là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 24d

Bảng 24d là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 24e

Bảng 24e là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là NH.

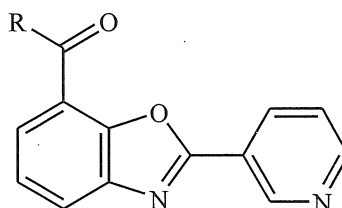
Bảng 24f

Bảng 24f là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 24g

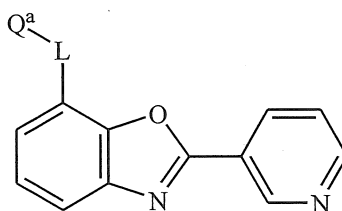
Bảng 24g là giống hệt với Bảng 24a, chỉ khác là L là C(O).

Bảng 25



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 26a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxo-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxo-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxo-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxo-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxo-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxo-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxo-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxo-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxo-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxo-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 26b

Bảng 26b là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là S.

Bảng 26c

Bảng 26c là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 26d

Bảng 26d là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 26e

Bảng 26e là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là NH.

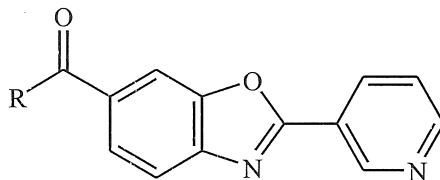
Bảng 26f

Bảng 26f là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 26g

Bảng 26g là giống hệt với Bảng 26a, chỉ khác là L là C(O).

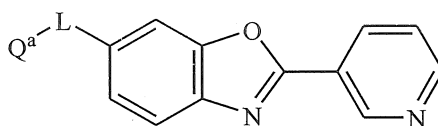
Bảng 27



R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu

1-metylxyclopropyl	3-metoxycyclobutyl	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-thietanyl	3,3-difloxyclobutyl
3-oxetanyl	-CH ₂ (oxiranyl)	3-thietanyl-1,1-dioxit
3-thietanyl-1-oxit	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahydro-2-furanyl)
-CH ₂ (2-furanyl)	tetrahydro-2-furanyl	-CH ₂ (2-thienyl)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difloxycyclopropyl)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metyl-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metyl-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (6-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metyl-2-pyridinyl)
-CH ₂ (3-metoxi-2-pyridinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (4-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-pyrimidinyl)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pyridinyl)
-CH ₂ (2-pyrimidinyl)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)phenyl)	-CH ₂ (6-bromo-2-pyridinyl)
-CH ₂ (5-metyl-2-pyrazinyl)	-CH ₂ (4-pyridinyl)	-CH ₂ (2-thiazolyl)
Ph	3-pyridinyl	-CH ₂ (2-pyridinyl)
2-pyridinyl	2-pyrazinyl	-CH ₂ (3-pyridinyl)
4-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyridinyl	-CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
3-CF ₃ -2-pyridinyl	4-CF ₃ -2-pyrimidinyl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-pyridinyl)
5-CF ₃ -2-pyridinyl	5-CF ₃ -2-pyrazinyl	6-CF ₃ -2-pyridinyl
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolyl)	5-CF ₃ -2-pyrimidinyl
		-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)

Bảng 28a



L là O

Q ^a	Q ^a
3-metyl-2-pyridinyl	3-metoxi-2-pyridinyl
3-(triflometyl)-2-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
4-metyl-2-pyridinyl	4-metoxi-2-pyridinyl
4-(triflometyl)-2-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
5-metyl-2-pyridinyl	5-metoxi-2-pyridinyl
5-(triflometyl)-2-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
6-metyl-2-pyridinyl	6-metoxi-2-pyridinyl
6-(triflometyl)-2-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyridinyl
2-metyl-3-pyridinyl	2-metoxi-3-pyridinyl
2-(triflometyl)-3-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
4-metyl-3-pyridinyl	4-metoxi-3-pyridinyl
4-(triflometyl)-3-pyridinyl	4-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
5-metyl-3-pyridinyl	5-metoxi-3-pyridinyl
5-(triflometyl)-3-pyridinyl	5-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
6-metyl-3-pyridinyl	6-metoxi-3-pyridinyl
6-(triflometyl)-3-pyridinyl	6-(CH(=NOMe))-3-pyridinyl
2-metyl-4-pyridinyl	2-metoxi-4-pyridinyl
2-(triflometyl)-4-pyridinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl
3-metyl-4-pyridinyl	3-metoxi-4-pyridinyl
3-(triflometyl)-4-pyridinyl	3-(CH(=NOMe))-4-pyridinyl

3-metyl-2-pyrazinyl	3-metoxo-2-pyrazinyl
3-(triflometyl)-2-pyrazinyl	3-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
5-metyl-2-pyrazinyl	5-metoxo-2-pyrazinyl
5-(triflometyl)-2-pyrazinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
6-metyl-2-pyrazinyl	6-metoxo-2-pyrazinyl
6-(triflometyl)-2-pyrazinyl	6-(CH(=NOMe))-2-pyrazinyl
4-metyl-2-pyrimidinyl	4-metoxo-2-pyrimidinyl
4-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	4-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
5-metyl-2-pyrimidinyl	5-metoxo-2-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-2-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-2-pyrimidinyl
2-metyl-4-pyrimidinyl	2-metoxo-4-pyrimidinyl
2-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	2-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
5-metyl-4-pyrimidinyl	5-metoxo-4-pyrimidinyl
5-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	5-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
6-metyl-4-pyrimidinyl	6-metoxo-4-pyrimidinyl
6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl	6-(CH(=NOMe))-4-pyrimidinyl
3-metyl-1-pyrazolyl	3-metoxo-1-pyrazolyl
3-(triflometyl)-1-pyrazolyl	3-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1-pyrazolyl	4-metoxo-1-pyrazolyl
4-(triflometyl)-1-pyrazolyl	4-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
5-metyl-1-pyrazolyl	5-metoxo-1-pyrazolyl
5-(triflometyl)-1-pyrazolyl	5-(CH(=NOMe))-1-pyrazolyl
4-metyl-1,2,3-triazin-2-yl	4-metoxo-1,2,3-triazin-2-yl
4-(triflometyl)-1,2,3-triazin-2-yl	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-yl
6-(2-pyrimidinyl)-2-pyridinyl	2-(2-pyridinyl)-4-thiazolyl
2-(2-thiazolyl)-4-thiazolyl	2-(2-pyrimidinyl)etynyl
1,3,4-oxadiazol-2-yl	tetrahydro-3-furanyl
tetrahydro-2-furanyl	4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3-isoxazolyl	phenyl
2-(triflometyl)phenyl	3-(triflometyl)phenyl
4-(triflometyl)phenyl	

Bảng 28b

Bảng 28b là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là S.

Bảng 28c

Bảng 28c là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là S(O).

Bảng 28d

Bảng 28d là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là SO₂.

Bảng 28e

Bảng 28e là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là NH.

Bảng 28f

Bảng 28f là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là NMe.

Bảng 28g

Bảng 28g là giống hệt với Bảng 28a, chỉ khác là L là C(O).

Hợp chất theo sáng chế sẽ thường được sử dụng dưới dạng hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống trong chế phẩm, tức là chế phẩm nông dụng, với 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, đóng vai trò là chất mang. Các thành phần của chế phẩm hoặc chế phẩm nông dụng được chọn để phù hợp với đặc tính vật lý của hoạt chất, cách thức bón và các yếu tố môi trường, như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Các chế phẩm nông dụng hữu ích bao gồm cả chế phẩm dạng lỏng lẫn chế phẩm dạng rắn. Chế phẩm dạng lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa), hỗn dịch, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, chế phẩm đậm đặc có thể chảy và/hoặc nhũ tương hỗn dịch) và tương tự, tùy ý có thể được làm đặc thành gel. Ví dụ về chế phẩm dạng lỏng chứa nước là chế phẩm đậm đặc hòa tan, hỗn dịch đậm đặc, nang hỗn dịch, nhũ tương đậm đặc, vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, chế phẩm đậm đặc có thể chảy và nhũ tương hỗn dịch. Ví dụ về chế phẩm dạng lỏng không chứa nước là chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa, chế phẩm đậm đặc có thể vi nhũ hóa, chế phẩm đậm đặc có thể phân tán và chế phẩm phân tán dạng dầu.

Ví dụ về chế phẩm dạng rắn là chế phẩm rắc, chế phẩm dạng bột, chế phẩm dạng cốm, chế phẩm dạng hạt cải, chế phẩm dạng hạt nhỏ, viên ngậm, viên nén, chế phẩm dạng màng được độn (bao gồm chế phẩm phủ hạt) và tương tự, có thể phân tán trong nước (“có thể hút ẩm”) hoặc hòa tan trong nước. Chế phẩm dạng màng hoặc chế phẩm phủ được điều chế từ dung dịch tạo màng hoặc hỗn dịch đặc có thể chảy biệt hữu ích để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao nang hoặc bao vi nang và tiếp tục điều chế thành hỗn dịch hoặc chế phẩm dạng rắn; theo cách khác toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc “phủ”). Chế phẩm dạng bao nang có thể kiểm soát và làm chậm giải phóng hoạt chất. Chế phẩm dạng cốm có thể nhũ hóa kết hợp ưu điểm của cả chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa và chế phẩm dạng cốm khan. Chế phẩm có độ ổn định cao thường được sử dụng dưới dạng chế phẩm trung gian để tiếp tục điều chế.

Chế phẩm có thể phun thường được phân tán trong môi trường thích hợp trước khi phun. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn này được bào chế để dễ dàng pha loãng trong môi trường phun, thường là nước, but occasionally môi trường thích hợp khác, như

hydrocarbon thơm hoặc parafin hoặc dầu thực vật. Thể tích phun có thể nằm trong khoảng từ một đến vài nghìn lít trên một hecta, tuy nhiên thường nằm trong khoảng từ mười đến vài trăm lít trên một hecta. Chế phẩm có thể phun có thể được trộn trong bình với nước hoặc môi trường thích hợp khác để xử lý lá bằng cách phun từ trên cao hoặc bón vào đất, hoặc để bón vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Chế phẩm dạng lỏng và chế phẩm dạng khan có thể được định lượng trực tiếp vào hệ thống tưới nhỏ giọt hoặc rãnh trong quá trình trồng. Chế phẩm dạng lỏng và chế phẩm dạng rắn có thể được bón cho hạt giống của cây trồng và thực vật mong muốn khác để xử lý hạt giống trước khi trồng để bảo vệ rễ phát triển và các bộ phận khác của cây trồng dưới mặt đất và/hoặc tán lá thông qua quá trình hấp thu hệ thống.

Chế phẩm theo sáng chế sẽ thường chứa lượng hữu hiệu của hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong các khoảng gần đúng sau và vừa đủ tối đa 100% khối lượng.

	Tỷ lệ phần trăm khối lượng		
	Hoạt chất	Chất pha loãng	Chất hoạt động bề mặt
Chế phẩm dạng cốm, viên nén và chế phẩm dạng bột có thể phân tán và hòa tan trong nước	0,001-90	0-99,999	0-15
Chế phẩm phân tán dạng dầu, hỗn dịch, nhũ tương, dung dịch (bao gồm chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa)	1-50	40-99	0-50
Chế phẩm rắn	1-25	70-99	0-5
Chế phẩm dạng cốm và chế phẩm dạng hạt cải	0,001-99	5-99,999	0-15
Chế phẩm có độ ổn định cao	90-99	0-10	0-2

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

Ví dụ về chất pha loãng dạng lỏng bao gồm nước, *N,N*-dimetylalkanamit (ví dụ *N,N*-dimetylformamit), limonen, dimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyrrolidon (ví dụ *N*-metylpyrrolidinon), alkyl phosphat (ví dụ trietylphosphat), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, đipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen carbonat, butylen carbonat, parafin (ví dụ dầu khoáng trắng, parafin tiêu chuẩn, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glycerol triaxetat, sorbitol, hydrocarbon thơm,

hydrocarbon mạch dài được khử 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, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác, như alkyl-lactat este, este đibazơ alkyl và aryl benzoat, γ -butyrolacton, và rượu, có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, no hoặc không no, như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-ethylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, rượu diaxeton, cresol và rượu benzylic. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm este glyxerol của axit béo no và không no (thông thường C_6 - C_{22}), như dầu hạt và quả thực vật (ví dụ dầu oliu, thầu dầu, lanh, vừng, ngô (bắp), lạc, hướng dương, hạt nho, cây rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải, dừa và hạt cọ), chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ mỡ bò, mỡ lợn, dầu lợn, dầu gan cá, dầu cá), và hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm axit béo được alkyl hóa (ví dụ metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa), trong đó axit béo này có thể được thu nhận bằng cách thủy phân este glyxerol có nguồn gốc thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng phương pháp chưng cất. Chất pha loãng dạng lỏng thông thường được mô tả trong Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Chế phẩm dạng rắn và chế phẩm dạng lỏng theo sáng chế chứa một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt (cũng được gọi là “chất có hoạt tính bề mặt”) thường biến đổi, làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Phụ thuộc vào bản chất của các nhóm thân nước và kỵ nước trên phân tử chất hoạt động bề mặt, chất hoạt động bề mặt có thể hữu ích làm chất làm ẩm, chất phân tán, chất nhũ hóa hoặc chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại thành chất hoạt động bề mặt dạng không ion, chất hoạt động bề mặt dạng anion hoặc chất hoạt động bề mặt dạng cation. Chất hoạt động bề mặt dạng không ion hữu ích cho chế phẩm theo sáng chế bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: rượu alkoxylat, như rượu alkoxylat trên cơ sở rượu tự nhiên và rượu tổng hợp (có thể mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và điều chế từ rượu và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng; amin etoxylat, alkanolamit và etoxyl-alkanolamit; alkoxyl-triglyxerit, như dầu hạt cải, dầu thầu dầu và dầu đậu tương được etoxyl hóa; alkylphenol alkoxylat, như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat,

đinonyl phenol etoxylat và đodexyl phenol etoxylat (điều chế từ phenol và etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); polyme khối điều chế từ etylen oxit hoặc propylen oxit và polyme khối đảo ngược ở đó các khối tận cùng được điều chế từ propylen oxit; axit béo được etoxyl hóa; este béo và dầu được etoxyl hóa; metyl este được etoxyl hóa; tristyrylphenol được etoxyl hóa (bao gồm hợp chất điều chế từ etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng); axit béo este, glycerol este, dẫn xuất lanolin, polyetoxyl-este, như este của polyetoxyl-sorbitan và axit béo, este của polyetoxyl-sorbitol và axit béo và este của polyetoxyl-glyxerol và axit béo; dẫn xuất sorbitan khác, như sorbitan este; chất hoạt động bề mặt polyme, như copolyme ngẫu nhiên, copolyme khối, nhựa alkyl-polyetylen glycol, polyme liên hợp hoặc polyme răng lược và polyme hình sao; polyetylen glycol; este của polyetylen glycol và axit béo; chất hoạt động bề mặt silicon; và dẫn xuất đường, như sucroza este, alkyl polyglycosit và alkyl polysacarit.

Chất hoạt động bề mặt dạng anion hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: axit alkylaryl sulfonic và muối của nó; rượu được carboxyl hóa hoặc alkylphenol etoxylat; dẫn xuất điphenyl sulfonat; lignin và dẫn xuất lignin, như liginosulfonat; axit maleic hoặc axit succinic hoặc anhydrit của chúng; olefin sulfonat; este phosphat, như este phosphat của rượu alkoxylat, este phosphat của alkylphenol alkoxylat và este phosphat của styryl phenol etoxylat; chất hoạt động bề mặt protein; dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của dầu và axit béo; sulfat và sulfonat của etoxyl-alkylphenol; sulfat của rượu; sulfat của rượu được etoxyl hóa; sulfonat của amin và amit, như *N,N*-alkyltaurat; sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và đodexyl và tridexylbenzen; sulfonat của naphtalen ngưng tụ; sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; sulfonat của dầu mỡ đã phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và dẫn xuất của chúng, như muối dialkyl sulfosuccinat.

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

Cũng hữu ích cho chế phẩm theo sáng chế là hỗn hợp chứa chất hoạt động bề mặt dạng không ion và chất hoạt động bề mặt dạng anion hoặc hỗn hợp chứa chất hoạt động bề mặt dạng không ion và chất hoạt động bề mặt dạng cation. Chất hoạt động bề mặt dạng không ion, chất hoạt động bề mặt dạng anion hoặc chất hoạt động bề mặt dạng cation và khuyến cáo sử dụng của chúng được mô tả trong các tài liệu *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; và A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể chứa các chất phụ trợ và chất bổ trợ công thức, đã biết trong lĩnh vực này dưới dạng chất hỗ trợ công thức (một số chất này có chức năng tương tự chất pha loãng dạng rắn, chất pha loãng dạng lỏng hoặc chất hoạt động bề mặt). Các chất phụ trợ và chất bổ trợ công thức này có thể kiểm soát: độ pH (chất đệm), tạo bọt trong quá trình xử lý (chất chống bọt, như polysiloxan hữu cơ), sự lắng hoạt chất (chất gây thấm ổn định), độ nhớt (chất làm đặc lưu biến), sự phát triển của vi sinh vật trong đồ chứa (chất kháng vi sinh vật), sự kết đông sản phẩm (chất chống kết đông), màu sắc (chất phân tán chất màu/chất nhuộm), rửa trôi (chất tạo màng hoặc chất kết dính), bay hơi (chất làm chậm bay hơi), và các đặc tính khác. Ví dụ về chất tạo màng bao gồm polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat, rượu polyvinyllic, copolyme của rượu polyvinyllic và sáp. Ví dụ về chất phụ trợ và chất bổ trợ công thức được mô tả trong tài liệu *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; và WO03/024222.

Hợp chất có công thức (1) và hoạt chất bất kỳ khác thường được kết hợp vào chế phẩm theo sáng chế bằng cách hòa tan hoạt chất trong dung môi hoặc nghiền trong chất pha loãng dạng lỏng hoặc chất pha loãng khan. Dung dịch, bao gồm chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa, có thể được điều chế bằng cách trộn các thành phần một cách đơn giản. Khi dung môi của chế phẩm dạng lỏng được sử dụng làm chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa là không đồng tan với nước, chất nhũ hóa thường được bổ sung vào để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Hỗn dịch đặc chứa hoạt chất, với đường kính hạt tối đa 2000µm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng máy nghiền để thu được hạt

có đường kính trung bình nhỏ hơn 3 μ m. Hỗn dịch đặc chứa nước có thể được điều chế thành hỗn dịch đậm đặc thành phẩm (ví dụ, xem U.S. 3,060,084) hoặc tiếp tục xử lý bằng cách sấy phun để thu được chế phẩm dạng cốm có thể phân tán trong nước. Chế phẩm dạng khô thường cần quy trình nghiền khô, tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 đến 10 μ m. Chế phẩm rắc và chế phẩm dạng bột có thể được điều chế bằng cách trộn và nghiền (như nghiền bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền sử dụng năng lượng thủy lực). Chế phẩm dạng cốm và chế phẩm dạng hạt cải có thể được điều chế bằng cách xịt dung dịch hoạt chất lên chất mang dạng hạt đã được điều chế trước hoặc bằng phương pháp 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, pp. 8-57 và các phiên bản tiếp theo, và WO 91/13546. Chế phẩm dạng hạt cải có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Chế phẩm dạng cốm có thể phân tán và hòa 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. Chế phẩm dạng 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 chế phẩm, xem T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *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 U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 và ví dụ 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 và 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, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 và ví dụ 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 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, toàn bộ các chế phẩm được điều chế bằng phương pháp thông thường. Chỉ số hợp chất liên quan đến các hợp chất trong bảng chỉ số A. Không cần thể hiện chi tiết, người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này hiểu rằng bằng cách sử dụng phần mô tả nêu trên có thể thực hiện sáng chế đến mức độ đầy đủ nhất. Do đó, các

ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh họa chứ không giới hạn phạm vi của sáng chế. Tỷ lệ phần trăm là tỷ lệ phần trăm khối lượng, trừ khi có quy định khác.

Ví dụ A

Chế phẩm đậm đặc có độ ổn định cao	
Hợp chất 2	98,5%
silic oxit dạng keo	0,5%
silic oxit tổng hợp vô định hình mịn	1,0%

Ví dụ B

Bột hút ẩm	
Hợp chất 32	65,0%
đodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
montmorillonit (nung)	23,0%

Ví dụ C

Chế phẩm dạng cốm	
Hợp chất 42	10,0%
cốm attapulgit (chất bay hơi thấp, 0,71/0,30mm; U.S.S. số. rây 25-50)	90,0%

Ví dụ D

Chế phẩm dạng hạt cải được ép đùn	
Hợp chất 48	25,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ E

Chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa	
Hợp chất 54	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
este metyl của axit béo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ví dụ F

Vi nhũ tương	
Hợp chất 59	5,0%
copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	30,0%
alkylpolyglycosit	30,0%
glyceryl monooleat	15,0%
nước	20,0%

Ví dụ G

Chế phẩm xử lý hạt giống	
Hợp chất 84	20,00%

copolyme polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat	5,00%
sáp axit montan	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%
copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
ruợu stearyllic (POE 20)	2,00%
polysilan hữu cơ	0,20%
chất màu đỏ	0,05%
nước	65,75%

Ví dụ H

Chế phẩm phân bón	
Hợp chất 85	2,5%
copolyme pyrrolidon-styren	4,8%
tristyrylphenyl 16-etoxyat	2,3%
talc	0,8%
tinh bột ngô	5,0%
phân bón giải phóng chậm	36,0%
cao lanh	38,0%
nước	10,6%

Ví dụ I

Hỗn dịch đậm đặc	
hợp chất 2	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 bột silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
nước	53,7%

Ví dụ J

Nhũ tương trong nước	
hợp chất 32	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 bột silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocarbon thơm dầu mỏ	20,0
nước	58,7%

Ví dụ K

Chế phẩm phân tán dạng dầu	
hợp chất 42	25%
polyoxyetylen sorbitol hexaoleat	15%
đất sét bentonit hữu cơ được cải biến	2,5%
este metyl của axit béo	57,5%

Ví dụ L

Nhũ tương hỗn dịch	
hợp chất 48	10,0%
imidacloprid	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 silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocarbon thơm dầu mỏ	20,0%
nước	53,7%

Hợp chất theo sáng chế kiểu có hoạt tính diệt dịch hại không xương sống phổ rộng. Các dịch hại này bao gồm động vật không xương sống cứ trú trong nhiều môi trường, ví dụ tán lá, rễ, đất, cây trồng đã thu hoạch hoặc các sản phẩm khác, tòa nhà hoặc lớp da động vật. Ví dụ về các dịch hại này bao gồm động vật không xương sống ăn tán lá (bao gồm lá, thân, hoa và quả), hạt giống, gỗ, sợi vải hoặc máu hoặc mô động vật, do đó gây tổn thương hoặc thiệt hại cho cây trồng nông nghiệp đang sinh trưởng hoặc được bảo quản, rừng, cây trồng trong nhà kính, cây cảnh, vườn ươm, sản phẩm được bảo quản hoặc sản phẩm dạng sợi, hoặc nhà cửa hoặc 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 trung bình trong lĩnh vực này sẽ hiểu rằng không phải toàn bộ các hợp chất đều có hiệu quả như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả các dịch hại.

Do đó, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế hữu ích để bảo vệ cây trồng nông nghiệp khỏi dịch hại không xương sống ăn thực vật, và các cây trồng và thực vật phi nông nghiệp khác khỏi dịch hại không xương sống ăn thực vật. Đặc tính hữu ích này bao gồm bảo vệ cây trồng và các thực vật khác (tức là cả nông nghiệp và phi nông nghiệp) chứa vật liệu di truyền được chèn vào bằng phương pháp thiết kế gen (tức là chuyển gen) hoặc cải biến bằng phương pháp đột biến gen để thu được các tính trạng có lợi. Ví dụ về các tính trạng này bao gồm khả năng chống chịu chất diệt cỏ, tính kháng dịch hại ăn thực vật (ví dụ côn trùng, ve, rệp vừng, nhện, giun tròn, ốc sên, vi nấm gây bệnh thực vật, vi khuẩn và virus), cải thiện khả năng sinh trưởng của thực vật, tăng khả năng chống chịu điều kiện sinh trưởng khắc nghiệt, như nhiệt độ cao hoặc thấp, độ ẩm của đất thấp hoặc cao, và độ mặn cao, tăng khả năng ra hoa và tạo quả, năng suất thu hoạch cao hơn, tăng trưởng nhanh hơn, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao

hơn, hoặc cải thiện đặc tính xử lý hoặc bảo quản của sản phẩm thu hoạch. Thực vật chuyển gen có thể được cải biến để biểu hiện nhiều tính trạng. Ví dụ về thực vật chứa các tính trạng được tạo ra bằng phương pháp thiết kế gen hoặc đột biến gen bao gồm các giống ngô, bông, đậu tương và khoai tây biểu hiện độc tố diệt dịch hại *Bacillus thuringiensis*, như YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® và NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™, và các giống ngô, bông, đậu tương và hạt cải có khả năng chống chịu chất diệt cỏ, như ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® và CLEARFIELD®, cũng như cây trồng biểu hiện *N*-axetyltransferaza (GAT) để tạo ra tính kháng chất diệt cỏ glyphosat, hoặc cây trồng chứa gen HRA tạo ra tính kháng chất diệt cỏ ức chế axetolactat synthaza (ALS). Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác hiệp đồng với các tính trạng được chèn vào bằng phương pháp thiết kế gen hoặc cải biến bằng phương pháp đột biến gen, nhờ đó tăng cường biểu hiện kiểu hình hoặc hiệu quả của các tính trạng hoặc tăng hiệu quả kiểm soát dịch hại không xương sống của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế. Cụ thể, hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác hiệp đồng với biểu hiện kiểu hình của protein hoặc các hợp chất tự nhiên khác gây độc cho dịch hại không xương sống để tạo ra hiệu quả kiểm soát dịch hại này cao hơn tác dụng hiệp đồng cộng.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể tùy ý chứa chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ chế phẩm 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. Đặc biệt là chế phẩm chứa ít nhất một chế phẩm 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 chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật có thể ở dạng lỏng hoặc rắn. Đặc biệt là chế phẩm dạng rắn ở dạng chế phẩm dạng cốm, viên dính nhỏ hoặc viên nén. Chế phẩm dạng rắn chứa chế phẩm phân bón có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế với chế phẩm phân bón cùng với các thành phần công thức, sau đó điều chế chế phẩm bằng các phương pháp, như tạo hạt hoặc ép đùn. Theo cách khác chế phẩm dạng rắn có thể được điều chế bằng cách xịt dung dịch hoặc hỗn dịch chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trong dung môi bay hơi vào chế phẩm phân bón đã được điều chế trước ở dạng hỗn hợp ổn định cấu trúc, ví dụ chế phẩm dạng cốm, viên dính nhỏ hoặc viên nén, sau đó làm bay hơi dung môi.

Việc sử dụng phi nông nghiệp liên quan đến kiểm soát dịch hại không xương sống ở các khu vực không phải là khu vực trồng cây. Việc sử dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế bao gồm kiểm soát dịch hại không xương sống trong sản phẩm hạt, hạt được bảo quản và các sản phẩm khác, và trong sản phẩm dệt, như quần áo và tấm thảm. Việc sử dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm kiểm soát dịch hại không xương sống ở cây cảnh, rừng, ở bãi chăn thả gia súc, dọc theo các tuyến đường và đường tàu, và trên sân cỏ, như bãi cỏ, sân golf và đồng cỏ. Việc sử dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm kiểm soát dịch hại không xương sống trong nhà và các công trình khác có người và/hoặc động vật liên quan, trang trại, vườn thú hoặc các động vật khác. Việc sử dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm kiểm soát dịch hại, như mối có thể hư hại các vật dụng bằng gỗ hoặc các vật liệu khác được sử dụng trong các tòa nhà.

Việc sử dụng phi nông nghiệp của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm bảo vệ sức khỏe người và động vật bằng cách kiểm soát dịch hại không xương sống ký sinh hoặc truyền nhiễm bệnh. Việc kiểm soát động vật ký sinh bao gồm kiểm soát động vật ngoại ký sinh ký sinh trên bề mặt cơ thể của động vật chủ (ví dụ vai, nách, bụng, bẹn) và động vật nội ký sinh ký sinh bên trong cơ thể của động vật chủ (ví dụ dạ dày, ruột, phổi, tĩnh mạch, dưới da, mô bạch huyết). Ví dụ về dịch hại truyền bệnh và ngoại ký sinh bao gồm bọ đỏ, ve, rận, muỗi, ruồi, bét và bọ chét. Động vật nội ký sinh bao gồm giun chỉ, giun móc và giun sán. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để kiểm soát toàn thân và/hoặc không toàn thân nhiễm khuẩn hoặc nhiễm trùng bằng cách ký sinh trên động vật. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế đặc biệt thích hợp để tiêu diệt dịch hại truyền bệnh và ngoại ký sinh. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để tiêu diệt động vật ký sinh gây bệnh cho động vật hoạt động trong nông nghiệp, như gia súc, cừu, dê, ngựa, lợn, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, chim, gà tây, vịt, ngỗng và ong; thú cưng và vật nuôi, như chó, mèo, chim nuôi và cá cảnh; cũng như động vật thử nghiệm, như chuột đồng, chuột lang, chuột cống và chuột nhắt. Bằng cách tiêu diệt các động vật ký sinh này, sự hư hỏng và giảm chất lượng sản phẩm (thịt, sữa, len, da, trứng, mật ong, v.v) được giảm, sao cho việc phun chế phẩm trừ dịch hại, chứa hợp chất theo sáng chế cho phép chăn nuôi gia súc có tính kinh tế và đơn giản hơn.

Ví dụ về dịch hại không xương sống trong môi trường nông nghiệp hoặc phi nông nghiệp bao gồm trứng, ấu trùng và dịch hại trưởng thành thuộc bộ cánh vẩy, như sâu cắn gié, sâu ngài đêm, sâu đo, và bướm đêm thuộc họ Noctuidae (ví dụ sâu đục thân màu hồng (*Sesamia inferens* Walker), sâu đục thân ngô (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), sâu đục thân Nam Mỹ (*Spodoptera eridania* Cramer), sâu bướm hại ngô (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), sâu xanh da láng (*Spodoptera exigua* Hübner), sâu khoang hại bông (*Spodoptera littoralis* Boisduval), sâu khoang sọc vàng (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), sâu xám (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), sâu ăn lá (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), sâu xanh đục trái (*Lithophane antennata* Walker), ngài đêm hại bắp cải (*Barathra brassicae* Linnaeus), sâu đo hại đậu tương (*Pseudoplusia includens* Walker), sâu đo hại bắp cải (*Trichoplusia ni* Hübner), sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens* Fabricius)); sâu đục thân, sâu tường, sâu kéo màng, sâu hình nón, sâu xanh hại bắp cải và sâu bướm ăn nhu mô lá và để lại bộ xương thuộc họ Pyralidae (ví dụ, sâu đục thân hại Ngô (*Ostrinia nubilalis* Hübner), sâu rốn cam (*Amyelois transitella* Walker), sâu kéo màng đục rễ ngô (*Crambus caliginosallus* Clemens), sâu kéo màng hại sắn củ (*Pyralidae: Crambinae*), như sâu kéo màng (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), sâu đục thân hại mía (*Chilo infuscatellus* Snellen), sâu đục thân hại cà chua (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), sâu cuốn lá nhỏ (*Cnaphalocrocis medinalis*), sâu cuốn lá nhỏ hại nho (*Desmia funeralis* Hübner), sâu xanh hại dưa (*Diaphania nitidalis* Stoll), bướm đêm hại lõi bắp cải (*Helluala hydralis* Guenée), sâu đục thân màu vàng (*Scirpophaga incertulas* Walker), sâu đục chồi sớm (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), sâu đục thân màu trắng (*Scirpophaga innotata* Walker), sâu đục thân ngọn chồi (*Scirpophaga nivella* Fabricius), sâu đục thân sọc nâu đầu đen hại lúa (*Chilo polychrysus* Meyrick), sâu đục thân 5 vạch đầu nâu (*Chilo suppressalis* Walker), sâu ăn đọt cải (*Crocidolomia binotalis* English)); sâu cuốn lá, sâu đục chồi, sâu đục hạt, và sâu đục quả thuộc họ Tortricidae (ví dụ, ngài đục quả óc chó (*Cydia pomonella* Linnaeus), ngài hại quả nho (*Endopiza viteana* Clemens), ngài hại quả (*Grapholita molesta* Busck), sâu bướm tuyết (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), sâu đục thân hại cam chanh (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), sâu cuốn lá đỏ (*Argyrotaenia velutinana* Walker), sâu cuốn lá hại thực vật họ hoa hồng (*Choristoneura rosaceana* Harris), ngài hại táo (*Epiphyas postvittana* Walker), ngài hại quả nho (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), ngài hại chồi táo (*Pandemis pyrusana* Kearfott), sâu cuốn lá ăn tạp (*Platynota stultana* Walsingham), sâu xanh hại cây ăn quả (*Pandemis cerasana* Hübner),

sâu nâu hại táo (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); và nhiều dịch hại cánh vảy có ý nghĩa về mặt kinh tế khác (ví dụ, sâu tơ hại bắp cải (*Plutella xylostella* Linnaeus), sâu hồng (*Pectinophora gossypiella* Saunders), ngài độc cương trúc (*Lymantria dispar* Linnaeus), sâu đục quả đào (*Carposina niponensis* Walsingham), sâu đục cành đào (*Anarsia lineatella* Zeller), ngài đục củ khoai tây (*Phthorimaea operculella* Zeller), sâu vẽ bùa (*Lithocolletis blanchardella* Fabricius), sâu ăn lá hại táo (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), sâu cuốn lá hại lúa (*Lerodea eufala* Edwards), sâu ăn lá hại táo (*Leucoptera scitella* Zeller)); trứng, nhộng và dịch hại trưởng thành thuộc bộ *Blattodea* bao gồm gián thuộc họ *Blattellidae* và *Blattidae* (ví dụ, gián đen (*Blatta orientalis* Linnaeus), gián Châu Á (*Blattella asahinai* Mizukubo), gián Đức (*Blattella germanica* Linnaeus), gián thân nâu (*Supella longipalpa* Fabricius), gián Mỹ (*Periplaneta americana* Linnaeus), gián nâu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gián Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius)), gián xám (*Periplaneta fuliginosa* Service), gián Úc (*Periplaneta australasiae* Fabr.), gián đốm (*Nauphoeta cinerea* Olivier) và gián cánh mịn (*Symptloce pallens* Stephens); trứng, ấu trùng ăn lá, ấu trùng ăn quả, ấu trùng ăn rễ, ấu trùng ăn hạt, ấu trùng ăn mô xốp và dịch hại trưởng thành thuộc bộ cánh cứng bao gồm một thuộc họ *Anthribidae*, *Bruchidae*, và *Curculionidae* (ví dụ, một bông (*Anthonomus grandis* Boheman), bọ vòi voi đục gốc lúa (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), một thóc (*Sitophilus granarius* Linnaeus), một lúa (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), một hại thâm có thường niên (*Listronotus maculicollis* Dietz), một vòi dài hại sên cỏ (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), một nháy vòi dài (*Sphenophorus venatus vestitus*), một vòi dài denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); bộ chét cánh cứng, bộ cánh cứng hại dưa chuột, sâu ăn rễ, bộ cánh cứng ăn lá, bộ cánh cứng hại khoai tây, và bộ cánh cứng hại lá thuộc họ *Chrysomelidae* (ví dụ, bộ cánh cứng hại khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), bọ rễ ngô sọc đen cánh vàng (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); bộ da và các bộ cánh cứng khác thuộc họ *Scarabaeidae* (ví dụ, bọ Nhật Bản (*Popillia japonica* Newman), bọ cánh cam (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), bọ da phân bố ở Bắc Mỹ (*Cyclocephala borealis* Arrow), bọ da phân bố ở Nam Mỹ (*Cyclocephala immaculata* Olivier hoặc *C. lurida* Bland), bọ phấn và bọ trắng (*Aphodius* spp.), bọ đen hại sên cỏ (*Ataenius spretulus* Haldeman), bọ xanh lục xuất hiện vào tháng sáu (*Cotinis nitida* Linnaeus), bọ cánh cứng Châu Á (*Maladera castanea* Arrow), vọ cánh cứng xuất hiện vào tháng năm/tháng sáu

(*Phyllophaga* spp và bộ da Châu Âu (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); bộ sinh sống ở các tấm thảm thuộc họ *Dermestidae*; sâu ăn lá thuộc họ *Elateridae*; bộ cánh cứng ăn vỏ cây thuộc họ *Scolytidae* và một thuộc họ *Tenebrionidae*.

Ngoài ra, dịch hại nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm: trứng, dịch hại trưởng thành và ấu trùng thuộc bộ cánh da bao gồm sâu tai thuộc họ *Forficulidae* (ví dụ, sâu tai Châu Âu (*Forficula auricularia* Linnaeus), sâu tai xám (*Chelisoches morio* Fabricius)); trứng, dịch hại chưa trưởng thành, dịch hại trưởng thành và nhộng thuộc bộ cánh nửa và bộ cánh đều, như rệp hại thực vật thuộc họ *Miridae*, ve sầu thuộc họ *Cicadidae*, bộ chết hại lá (ví dụ *Empoasca* spp.) thuộc họ *Cicadellidae*, rệp giường (ví dụ, *Cimex lectularius* Linnaeus) thuộc họ *Cimicidae*, rầy thuộc họ *Fulgoroidae* và *Delphacidae*, bộ gai thuộc họ *Membracidae*, bộ chết thuộc họ *Psyllidae*, ruồi trắng thuộc họ *Aleyrodidae*, rệp thuộc họ *Aphididae*, rệp hại rễ nho thuộc họ *Phylloxeridae*, sâu ăn bột thuộc họ *Pseudococcidae*, bọ vẩy thuộc họ *Coccidae*, *Diaspididae* và *Margarodidae*, rệp cây thuộc họ *Tingidae*, bộ xít thuộc họ *Pentmoleculidae*, bộ rệp (ví dụ, bộ xít hại lúa mì (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) và bộ rệp phân bố ở miền Nam nước Mỹ (*Blissus insularis* Barber)) và bộ gây hại cho hạt cây khác thuộc họ *Lygaeidae*, bộ nhảy thuộc họ *Cercopidae*, bộ gây hại cho cây họ bầu bí thuộc họ *Coreidae*, và bộ đỏ và bộ hại bông thuộc họ *Pyrrhocoridae*.

Dịch hại nông nghiệp và phi nông nghiệp cũng bao gồm: trứng, ấu trùng, nhộng và dịch hại trưởng thành thuộc bộ mạt, như nhện ve và nhện ve đỏ thuộc họ *Tetranychidae* (ví dụ, nhện ve đỏ Châu Âu (*Panonychus ulmi* Koch), nhện ve hai đốm (*Tetranychus urticae* Koch), nhện McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); nhện chằng tơ giả thuộc họ *Tenuipalpidae* (ví dụ, nhện chằng tơ giả hại cam chanh (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); nhện hại chồi và gây bệnh gỉ thuộc họ *Eriophyidae* và các loài nhện ăn lá khác và các loài nhện quan trọng đối với sức khỏe của người và động vật, tức là mạt bụi nhà thuộc họ *Epidermoptidae*, mạt ký sinh ở nang lông thuộc họ *Demodicidae*, mạt gây hại cho hạt thuộc họ *Glycyphagidae*; ve thuộc họ *Ixodidae*, thường được gọi là ve cánh cứng (ví dụ, ve hươu (*Ixodes scapularis* Say), ve Úc (*Ixodes holocyclus* Neumann), ve chó Mỹ (*Dermacentor variabilis* Say), ve đỏ hình sao (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) và ve thuộc họ *Argasidae*, có tên thông dụng là ve cánh mềm (ví dụ, ve gây sốt định kỳ (*Ornithodoros turicata*), ve ký sinh trên gia cầm (*Argas radiatus*)); ghẻ và mạt ngứa thuộc họ *Psoroptidae*, *Pyemotidae*, và *Sarcoptidae*; trứng, dịch hại trưởng

thành và dịch hại chưa trưởng thành thuộc bộ cánh thẳng bao gồm cào cào, châu chấu và dế trũi (ví dụ, cào cào di cư (ví dụ, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), cào cào Mỹ (ví dụ, *Schistocerca americana* Drury), châu chấu hoang (*Schistocerca gregaria* Forskal), cào cào di cư (*Locusta migratoria* Linnaeus), châu chấu bụi (*Zonocerus* spp.), dế nhà (*Acheta domesticus* Linnaeus), dế trũi (ví dụ, dế trũi vàng nâu (*Scapteriscus vicinus* Scudder) và dế trũi phân bố ở Nam Mỹ (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); trứng, dịch hại trưởng thành và dịch hại chưa trưởng thành thuộc bộ hai cánh bao gồm sâu ăn lá (ví dụ, *Liriomyza* spp. như sâu ăn và gây xoắn lá (*Liriomyza sativae* Blanchard)), muỗi, ruồi giấm (*Tephritidae*), ruồi lúa mỳ (ví dụ, *Oscinella frit* Linnaeus), sâu đất, ruồi nhà (ví dụ, *Musca domestica* Linnaeus), ruồi nhà nhỏ (ví dụ, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), ruồi chuồng trại (ví dụ, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), ruồi ký sinh trên mặt động vật, ruồi trâu, trứng ruồi (ví dụ, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), và các loài ruồi gây bệnh khác, con mòng (ví dụ, *Tabanus* spp.), ruồi ngựa (ví dụ, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), ruồi gia súc (ví dụ, *Hypoderma* spp.), ruồi vàng (ví dụ, (*Chrysops* spp.), ruồi cừu (ví dụ, *Melophagus ovinus* Linnaeus) và các loài *Brachycera* khác, muỗi (ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), ruồi đen (ví dụ, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), muỗi vằn, ruồi cát, ruồi nấm, và các loài ruồi (*Nematocera*) khác; trứng, dịch hại trưởng thành và dịch hại chưa trưởng thành thuộc bộ *Thysanoptera* bao gồm bộ trĩ hại hành tây (*Thrips tabaci* Lindeman), bộ trĩ hoa (*Frankliniella* spp.), và các loài bộ trĩ ăn lá khác; côn trùng thuộc bộ cánh màng bao gồm kiến thuộc họ *Formicidae* bao gồm kiến thợ (*Camponotus floridanus* Buckley), kiến thợ đỏ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), kiến thợ đen (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), kiến chân trắng (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), kiến đầu to (*Pheidole* sp.), kiến ma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); kiến khổng lồ (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), kiến lửa nhỏ (*Wasmannia auropunctata* Roger), kiến lửa (*Solenopsis geminata* Fabricius), kiến lửa đỏ (*Solenopsis invicta* Buren), kiến Argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), kiến đen điên (*Paratrechina longicornis* Latreille), kiến vỉa hè (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), kiến ở ruộng ngô (*Lasius alienus* Förster) và kiến dừa (*Tapinoma sessile* Say). Các côn trùng thuộc bộ cánh màng khác bao gồm ong (bao gồm ong thợ), ong, ong vàng, ong bắp cày, và sâu ong (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); côn trùng thuộc bộ mối bao gồm mối thuộc họ *Termitidae* (ví dụ, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), *Kalotermitidae* (ví

dụ, *Cryptotermes* sp.), và *Rhinotermitidae* (ví dụ, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), môi đất phân bố ở miền đông nước Mỹ (*Reticulitermes flavipes* Kollar), môi đất phân bố ở miền tây nước Mỹ (*Reticulitermes hesperus* Banks), môi đất (*Coptotermes formosanus* Shiraki), môi gỗ phân bố ở miền tây Ấn Độ (*Incisitermes immigrans* Snyder), môi bột (*Cryptotermes brevis* Walker), môi gỗ (*Incisitermes snyderi* Light), môi đất phân bố ở miền nam nước Mỹ (*Reticulitermes virginicus* Banks), môi gỗ phân bố ở miền tây nước Mỹ (*Incisitermes minor* Hagen), môi sống ở trên cây, như *Nasutitermes* sp. và các loài mối có ý nghĩa về mặt kinh tế khác; côn trùng thuộc bộ *Thysanura*, như bộ bạc (*Lepisma saccharina* Linnaeus) và bộ nâu (*Thermobia domestica* Packard); côn trùng thuộc bộ *Mallophaga* và bao gồm chấy đầu (*Pediculus humanus capitis* De Geer), chấy thân (*Pediculus humanus* Linnaeus), rận gà (*Menacanthus stramineus* Nitsch), rận chó (*Trichodectes canis* De Geer), rận lông (*Goniocotes gallinae* De Geer), rận cừu (*Bovicola ovis* Schrank), rận bò mũi ngắn (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), rận bò mũi dài (*Linognathus vituli* Linnaeus) và các loài bọ và rận khác gây bệnh cho người và động vật; côn trùng thuộc bộ *Siphonoptera* bao gồm bọ chuột (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), bọ mèo (*Ctenocephalides felis* Bouche), bọ chó (*Ctenocephalides canis* Curtis), bọ gà (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), bọ chết ngực giữa không có ống thở (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), bọ chết gây bệnh cho người (*Pulex irritans* Linnaeus) và các loài bọ chết gây bệnh cho động vật có vú và gia cầm khác. Các động vật chân đốt khác có thể được kiểm soát theo sáng chế bao gồm: nhện thuộc bộ *Araneae*, như nhện nâu (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) và nhện áo đen (*Latrodectus mactans* Fabricius), và rết thuộc bộ *Scutigermorpha*, như rết nhà (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ví dụ về dịch hại không xương sống gây hại cho hạt bảo quản bao gồm một đục hạt lớn (*Prostephanus truncatus*), một đục hạt nhỏ (*Rhyzopertha dominica*), một lúa (*Stiophilus oryzae*), một ngô (*Stiophilus zeamais*), một đậu đũa (*Callosobruchus maculatus*), một bột đỏ (*Tribolium castaneum*), một thóc (*Stiophilus granarius*), ngài Ấn Độ (*Plodia interpunctella*), bướm Địa Trung Hải (*Ephestia kuhniella*) và một ngũ cốc dẹt hoặc một ăn phôi hạt (*Cryptolestis ferrugineus*).

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt dịch hại thuộc lớp *Nematoda*, *Cestoda*, *Trematoda*, và *Acanthocephala* bao gồm các loài có ý nghĩa về mặt kinh tế thuộc bộ *Strongylida*, *Ascaridida*, *Oxyurida*, *Rhabditida*, *Spirurida*, và *Enoplida* bao gồm, nhưng

không chỉ giới hạn ở các dịch hại có ý nghĩa về mặt kinh tế (tức là giun tròn gây sần rễ thuộc chi *Meloidogyne*, giun tròn gây tổn thương rễ thuộc chi *Pratylenchus*, giun tròn gây lùn rễ thuộc chi *Trichodorus*, v.v.) và các dịch hại gây nguy hiểm cho sức khỏe của người và động vật (tức là toàn bộ các loài sán lá, sán dây, và giun đũa có ý nghĩa về mặt kinh tế, như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara canis* 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 diệt dịch hại thuộc bộ cánh vảy (ví dụ, *Alabama argillacea* Hübner (sâu cuốn lá bông), *Archips argyrospila* Walker (sâu cuốn lá hại trái cây), *A. rosana* Linnaeus (sâu cuốn lá Châu Âu) và các loài sâu cuốn lá (*Archips*) khác, *Chilo suppressalis* Walker (sâu đục thân hại lúa), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (sâu cuốn lá lúa), *Crambus caliginosallus* Clemens (sâu kéo màng đục rễ ngô), *Crambus teterrellus* Zincken (sâu kéo màng hại sắn củ), *Cydia pomonella* Linnaeus (ngài đục quả óc chó), *Earias insulana* Boisduval (sâu đục trái), *Earias vittella* Fabricius (sâu đục trái đậu bắp), *Helicoverpa armigera* Hübner (sâu xanh), *Helictrungpa zea* Boddie (sâu tai hại ngô), *Heliothis virescens* Fabricius (sâu đục chồi thuốc lá), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sâu kéo màng), *Lobesia botrana* Denis & Schifferrmüller (ngài hại quả nho), *Pectinophora gossypiella* Saunders (sâu hồng), *Phyllocnistis citrella* Stainton (sâu ăn lá cây họ cam), *Pieris brassicae* Linnaeus (bướm bắp cải trắng), *Pieris rapae* Linnaeus (sâu xanh bướm trắng), *Plutella xylostella* Linnaeus (sâu tơ hại bắp cải), *Spodoptera exigua* Hübner (sâu xanh da láng), *Spodoptera litura* Fabricius (sâu khoang hại thuốc lá), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (sâu bướm hại ngô), *Trichoplusia ni* Hübner (sâu đo hại cải bắp) và *Tuta absoluta* Meyrick (sâu ăn lá cà chua)).

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính diệt dịch hại thuộc bộ cánh đều bao gồm: *Acyrtosiphon pisum* Harris (rệp đào), *Aphis craccivora* Koch (rệp đậu đũa), *Aphis fabae* Scopoli (rệp đậu đen), *Aphis gossypii* Glover (rệp bông, rệp dưa), *Aphis pomi* De Geer (rệp táo), *Aphis spiraeicola* Patch (rệp mơ), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (rệp mao địa hoàng), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (rệp dâu tây), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (rệp lúa mì), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (rệp táo màu hồng), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (rệp táo có lông tơ), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (rệp mạn), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (rệp củ cải), *Metopolophium dirrhodum* Walker (rệp ngũ cốc), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (rệp khoai tây), *Myzus persicae* Sulzer (rệp

khoai tây-đào, rệp đào), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (rệp rau diếp), *Pemphigus* spp. (rệp hại rễ và rệp hại mụn cây), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (rệp hại lá ngô), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (rệp lúa mạch-anh đào vàng), *Schizaphisginum Rondani* (rệp muối), *Sitobion avenae* Fabricius (rệp hạt), *Therioaphis maculata* Buckton (rệp đốm hại cỏ đỉnh lăng), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (rệp đen hại cam chanh), và *Toxoptera citricida* Kirkaldy (rệp nâu hại cam chanh); *Adelges* spp. (bọ lông); *Phylloxera devastatrix* Pergande (rệp rễ nhỏ); *Bemisia tabaci* Gennadius (bướm trắng hại thuốc lá, bướm trắng hại khoai lang), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (bướm trắng gây bạc lá), *Dialeurodes citri* Ashmead (bướm trắng hại cam chanh) và *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (bướm trắng nhà kính); *Empoasca fabae* Harris (rầy xanh lá mạ), *Laodelphax striatellus* Fallen (rầy nâu nhỏ hại lúa), *Macroleste quadrilineatus* Forbes (rầy cúc tây), *Nephotettix cincticeps* Uhler (rầy xanh), *Nephotettix nigropictus* Stål (rầy xanh hại lúa), *Nilaparvata lugens* Stål (rầy nâu hại lúa), *Peregrinus maidis* Ashmead (rầy hại ngô), *Sogatella furcifera* Horvath (rầy đen trắng), *Sogatodes orizicola* Muir (rầy châu Mỹ hại lúa), *Typhlocyba pomaria* McAtee (rầy trắng hại táo), *Erythroneoura* spp. (bọ chết hại lá nhỏ); *Magacidada septendecim* Linnaeus (ve sầu Bắc Mỹ); *Icerya purchasi* Maskell (rệp sáp bông), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (rệp sáp vảy ốc đen); *Planococcus citri* Risso (rệp sáp hại cam chanh); *Pseudococcus* spp. (các loài rệp sáp khác); *Cacopsylla pyricola* Foerster (bọ đào), *Trioza diospyri* Ashmead (bọ chết hồng vàng).

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính diệt dịch hại thuộc bộ cánh nửa bao gồm: *Acrosternum hilare* Say (bọ xít xanh), *Anasa tristis* De Geer (bọ hại cây họ bầu bí), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (bọ rệp), *Cimex lectularius* Linnaeus (bọ giường), *Corythuca gossypii* Fabricius (bọ ăn cây bông), *Cyrtopeltis modesta* Distant (bọ hại cà chua), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (bọ bông), *Euchistus servus* Say (bọ xít nâu), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (bọ xít một đốm), *Graptosthetus* spp. (chỉ bọ hại hạt cây), *Halymorpha halys* Stål (bọ xít nâu), *Leptoglossus corculus* Say (bọ ăn cuống lá thông), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (rệp cây), *Nezara viridula* Linnaeus (bọ xít xanh), *Oebalus pugnax* Fabricius (bọ xít hại hạt lúa), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (bọ hại bông tai lớn của cây đậu), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (rầy hại bông). Các bộ côn trùng khác có thể được kiểm soát bằng hợp chất theo sáng chế bao gồm *Thysanoptera* (ví dụ, *Frankliniella occidentalis* Pergande (bọ trĩ hoa phân bố ở miền tây

nước Mỹ), *Scirtothrips citri* Moulton (bọ trĩ hại cam chanh), *Sericothrips variabilis* Beach (bọ trĩ hại đậu tương), và *Thrips tabaci* Lindeman (bọ trĩ hại hành tây); và bộ cánh cứng (ví dụ, *Leptinotarsa decemlineata* Say (bọ khoai tây Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (bọ đậu Mexico) và sâu ăn lá thuộc các chi *Agriotes*, *Athous* hoặc *Limonius*).

Đã biết rằng một số hệ thống phân loại hiện đại xếp bộ cánh đều (*Homoptera*) là phân bộ thuộc bộ cánh nửa (*Hemiptera*).

Đặc biệt hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát bọ trĩ hoa (*Frankliniella occidentalis*). Đặc biệt hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát rầy xanh hại lá khoai tây (*Empoasca fabae*). Đặc biệt hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát rệp dưa (*Aphis gossypii*). Đặc biệt hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát rệp đào (*Myzus persicae*). Đặc biệt hợp chất theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát bọ phấn (*Bemisia tabaci*).

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể hữu ích để làm tăng sức khỏe của cây trồng. Phương pháp này bao gồm bước cho cây trồng (ví dụ tán lá, hoa, quả hoặc rễ) hoặc hạt giống cây trồng được sinh trưởng từ đó tiếp xúc với hợp chất có công thức (1) ở lượng đủ để đạt được sức khỏe mong muốn của thực vật (tức là lượng hữu hiệu). Thông thường hợp chất có công thức (1) được bón ở dạng chế phẩm được điều chế. Mặc dù hợp chất có công thức (1) thường được bón trực tiếp vào cây trồng hoặc hạt giống của nó, hợp chất này cũng có thể được bón vào môi trường sinh trưởng của cây trồng, tức là môi trường sinh sống của cây trồng, đặc biệt môi trường xung quanh để cho phép hợp chất có công thức (1) thấm vào cây trồng. Môi trường liên quan đến phương pháp này thường bao gồm môi trường sinh trưởng (tức là môi trường cung cấp chất dinh dưỡng cho thực vật), thông thường đất trong đó thực vật được sinh trưởng. Do đó phương pháp xử lý cây trồng để làm tăng sức khỏe của cây trồng bao gồm bước cho cây trồng, hạt giống mà cây trồng sinh trưởng từ đó hoặc môi trường sinh trưởng của cây trồng tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1).

Sức khỏe cây trồng được gia tăng có thể tạo ra một hoặc nhiều tác dụng sau: (a) tạo ra cây trồng tối ưu được kiểm chứng khả năng nảy mầm rất cao của hạt giống, sự nảy mầm của cây trồng và cây trồng thẳng đứng; (b) tăng cường sinh trưởng cây trồng như được kiểm chứng bằng sự phát triển nhanh và sinh trưởng lá khỏe mạnh (ví dụ được đánh

giá bằng chỉ số diện tích lá), chiều cao thực vật, số lượng chồi (ví dụ đối với lúa), sinh khối rễ và khối lượng khô tổng số của sinh khối dinh dưỡng của cây trồng; (c) cải thiện năng suất cây trồng, như được kiểm chứng bằng thời điểm ra hoa, thời gian ra hoa, số lượng hoa, tổng sinh khối tích tụ (tức là năng suất) và/hoặc chất lượng quả hoặc hạt (tức là năng suất); (d) tăng cường khả năng của cây trồng để chống chịu hoặc ngăn ngừa lây nhiễm dịch bệnh và động vật chân đốt, giun tròn hoặc động vật thân mềm; và (e) tăng cường khả năng của cây trồng để chống chịu với điều kiện môi trường khắc nghiệt, như tiếp xúc với điều kiện nhiệt độ cao, độ ẩm không tối ưu hoặc hóa chất gây độc thực vật.

Hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức khỏe của cây trồng đã được xử lý so với cây trồng không được xử lý bằng cách tiêu diệt hoặc phòng ngừa đặc tính ăn của dịch hại không xương sống ăn thực vật trong môi trường sinh sống của thực vật. Trong sự vắng mặt của kiểm soát dịch hại không xương sống ăn thực vật, dịch hại làm giảm sức khỏe thực vật bằng cách tiêu thụ mô hoặc nhựa thực vật và truyền tác nhân gây bệnh thực vật, như virus. Ngay cả khi vắng mặt dịch hại không xương sống ăn thực vật, hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức khỏe cây trồng bằng cách cải biến chuyển hóa của thực vật. Nhìn chung, sức khỏe của cây trồng sẽ được gia tăng đáng kể bằng cách xử lý thực vật này với hợp chất theo sáng chế khi thực vật này được sinh trưởng trong môi trường không lý tưởng, tức là môi trường chứa một hoặc nhiều yếu tố bất lợi cho thực vật trong việc đạt được đặc tính di truyền đầy đủ như trong môi trường lý tưởng.

Đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường chứa dịch hại không xương sống ăn thực vật. Cũng đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường không chứa dịch hại không xương sống ăn thực vật. Cũng đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này được sinh trưởng trong môi trường chứa độ ẩm thấp hơn độ ẩm lý tưởng để hỗ trợ tăng trưởng của cây trồng. Đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này là lúa. Cũng đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này là bắp (ngô). Cũng đặc biệt là phương pháp tăng sức khỏe của cây trồng, trong đó cây trồng này là đậu tương.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc nhiều hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác bao gồm chất diệt côn trùng, chất diệt nấm, chất diệt giun tròn, chất diệt khuẩn, chất diệt ve, chất diệt cỏ, chất an toàn diệt cỏ, chất điều hòa

sinh trưởng, như chất ức chế lột xác côn trùng và chất kích thích tạo rễ, chất gây vô sinh, hóa chất truyền tin, chất trừ sâu, chất thu hút côn trùng, kích dục tổ, chất kích thích ăn, hợp chất có hoạt tính sinh học khác hoặc vi khuẩn ký sinh và gây bệnh, virus hoặc vi nấm để thu được chế phẩm trừ dịch hại nhiều thành phần có độ hữu ích nông nghiệp và phi nông nghiệp phổ rộng. Do đó, sáng chế cũng đề cập đến chế phẩm trừ dịch hại, chứa lượng hữu hiệu 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 dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, và ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác có thể được bào chế cùng với hợp chất theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức (1), để thu được a premix, hoặc hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác có thể được bào chế riêng so với hợp chất theo sáng chế, bao gồm hợp chất có công thức (1), và hai chế phẩm này được kết hợp với nhau trước khi bón (ví dụ trong bình phun) hoặc theo cách khác, bón lần lượt.

Ví dụ về hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác có thể được bào chế với hợp chất theo sáng chế bao gồm chất diệt côn trùng, như abamectin, acephat, acequinocyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen ([[(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(xyclopropylcarbonyl)oxy]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-đecahydro-6,12-dihydroxy-4,6*a*,12*b*-trimetyl-11-oxo-9-(3-pyridinyl)-2*H*,11*H*-naphto[2,1-*b*]pyrano[3,4-*e*]pyran-4-yl]metyl xyclopropanecarboxylat), amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazat, bistrifluron, borat, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorfluaaron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozit, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprol (3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), cyclaniliprol (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)amino]carbonyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xycloprothrin, xycloxaprid ((5*S*,8*R*)-1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2,3,5,6,7,8-hexahydro-9-nitro-5,8-Epoxy-1*H*-imidazo[1,2-*a*]azepin) cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gama-cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazin, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimetoat,

dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxit, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerat, fipronil, flometoquin (2-etyl-3,7-dimetyl-6-[4-(triflometoxy)phenoxy]-4-quinolinylyl metyl carbonat), flonicamid, flubendiamit, flucythrinat, 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, flupiprol (1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-5-[(2-metyl-2-propen-1-yl)amino]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1H-pyrazol-3-carbonitril), flupyradifuron (4-[[[(6-clo-3-pyridinyl)metyl](2,2-difloetyl)amino]-2(5H)-furanon]), fluvalinat, tau-fluvalinat, fonophos, formetanat, fosthiazat, halofenozit, heptafluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2-dimetyl-3-[(1Z)-3,3,3-triflo-1-propen-1-yl]xyclopropancarboxylat), hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidaclopid, indoxacarb, xà phòng diệt côn trùng, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl (1R,3S)-3-(2,2-dicloetenyl)-2,2-dimetylxyclopropancarboxylat), metaflumizon, metaldehyt, methamidophos, methidathion, methiodicarb, metomyl, metopren, metoxychlor, metofluthrin, metoxyfenozit, metofluthrin, monocrotophos, monoflothrín ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 3-(2-xyano-1-propen-1-yl)-2,2-dimetylxyclopropancarboxylat), nicotin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargit, protrifenbute, pyflubumid (1,3,5-trimetyl-N-(2-metyl-1-oxopropyl)-N-[3-(2-metylpropyl)-4-[2,2,2-triflo-1-metoxyl-1-(triflometyl)etyl]phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit), pymetrozin, pyrafluprol, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin (metyl (αE)-2-[[[2-[(2,4-diclophenyl)amino]-6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl]oxy]metyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat), pyriprol, pyriproxyfen, rotenon, ryanodin, silafluofen, spinetoram, spinosad, spiroidiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor (N-[metyloxido[1-[6-(triflometyl)-3-pyridinyl]etyl]- λ^4 -sulfanyliđen]xyanamit), tebufenozit, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2,3,3-tetrametylxyclopropancarboxylat), tetraniliprol, thiachlopid, thiametoxam, thiodicarb,

thiosultap-natri, tioazafen (3-phenyl-5-(2-thienyl)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpyrad, tralomethrin, triazamat, trichlorfon, triflumezopyrim (muối nội 2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2H-pyrido[1,2-a]pyrimidin), triflumuron, nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn ký sinh và gây bệnh, virus ký sinh và gây bệnh và vi nấm ký sinh và gây bệnh.

Đặc biệt là chất diệt côn trùng, như abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprol, cyclaniliprol, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gama-cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprol, flupyradifuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazat, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizon, methiodicarb, metomyl, metopren, metoxyfenozit, metofluthrin, monoflothin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pyflubumid, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodin, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamat, triflumezopyrim, triflumuron, nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*, toàn bộ các chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ các chủng virus nhiều hạt.

Theo một phương án, hoạt chất sinh học để trộn với hợp chất theo sáng chế bao gồm vi khuẩn ký sinh và gây bệnh, như *Bacillus thuringiensis*, và nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis*, như chất diệt côn trùng sinh học MVP® và MVP-II® được điều chế bằng phương pháp CellCap® (CellCap®, MVP® và MVP-II® là các nhãn hiệu của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); vi nấm ký sinh và gây bệnh, như vi nấm gây bệnh trên nho xanh; và virus ký sinh và gây bệnh (có trong tự nhiên lẫn được cải biến gen) bao gồm virus baculo, virus nhiều hạt (NPV), như virus *Helicoverpa zea* chứa nhiều hạt (HzNPV), virus *Anagrapha falcifera* chứa nhiều hạt (AfNPV); và virus tạo hạt (GV), như virus tạo hạt *Cydia pomonella* (CpGV).

Đặc biệt là hợp chất theo sáng chế được kết hợp với hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống khác thuộc nhóm khác hoặc có vị trí tác dụng khác với hợp chất có công thức (1). Theo một số phương án, hợp chất theo sáng chế được kết hợp với ít nhất một hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống khác có phổ kiểm soát tương tự nhưng có vị trí tác dụng khác sẽ đặc biệt có lợi để kiểm soát tính kháng. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa lượng hữu hiệu của ít nhất một hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung có phổ kiểm soát tương tự nhưng thuộc nhóm khác hoặc có vị trí tác dụng khác. Các hoạt chất hoặc hợp 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 chlorpyrifos hữu cơ; chất đối kháng kênh clorua được điều hòa bởi axit gama-aminobutyric, như xyclođien dieldrin và endosulfan, và phenylpyrazol ethiprol và fipronil; chất điều hòa kênh natri, như pyrethroid bifenthrin, cyfluthrin, *beta*-cyfluthrin, cyhalothrin, *lamda*-cyhalothrin, cypermethrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerat, metofluthrin và profluthrin; chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic, như neonicotinoit axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazin, thiachloprid, và thiametoxam, and sulfoxaflor; chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể axetylcholin nicotinic, như spinosyns spinetoram và spinosad; chất hoạt hóa kênh clorua, như avermectin abamectin và emamectin; chất có cấu trúc tương tự hormon kích thích sâu non, như diofenolan, metopren, fenoxycarb và pyriproxyfen; chất phong bế chọn lọc khả năng ăn của dịch hại cánh đều, như pymetrozin và flonicamid; chất ức chế sinh trưởng của ve, như etoxazol; chất ức chế ATP synthaza ty lập thể, như propargit; chất ngăn cản phosphoryl oxy hóa nhờ phá hủy gradien proton, như chlorfenapyr; chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinic, như chất tương tự nereistoxin cartap; chất ức chế sinh tổng hợp kitin, như benzoylure flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron, và buprofezin; chất gây rối loạn rụng lông ở côn trùng hai cánh, như cyromazin; chất chủ vận thụ thể ecdyson, như diaxylhydrazin metoxyfenozit và tebufenozit; chất chủ vận thụ thể octopamin, như amitraz; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp ty lập thể III, như hydrametylnon; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp ty lập thể I, như pyridaben; chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện áp, như Indoxacarb; chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, như axit tetronic và tetramic spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp ty lập thể II, như

β -ketonitril cyenopyrafen và cyflumetofen; chất điều hòa thụ thể ryanidin, như anthranilic điamit chlorantraniliprol, cyantraniliprol và cyantraniliprol, điamit, như flubendiamit, và phối tử thụ thể ryanodin, như ryanodin, hợp chất có trung tâm hoạt động tạo hoạt tính sinh học chưa biết, như azadirachtin, bifenazat, pyridalyl, pyrifluquinazon và triflumezopyrim; chất gây rối loạn hệ vi sinh vật ở màng ruột giữa của côn trùng, như *Bacillus thuringensis* và nội độc tố delta của chúng và *Bacillus sphaericus*; và hoạt chất sinh học bao gồm virus nhiều hạt (NPV) và virus trừ dịch hại có trong tự nhiên hoặc được cải biến gen khác.

Ngoài ra, hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác có thể kết hợp với hợp chất theo sáng chế bao gồm chất diệt nấm, như acibenzolar-S-metyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazin, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl (bao gồm benalaxyl-M), benodanil, benomyl, benthiavalicarb (bao gồm benthiavalicarb-isopropyl), benzovindiflupyr, bethoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, boscalid, bromuconazol, bupirimat, buthiobat, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, chlozolinat, đồng hydroxit, đồng oxychloride, đồng sulfat, coumoxystrobin, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazol, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezin, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimethirimol, dimetomorph, dimoxystrobin, diniconazol (bao gồm diniconazol-M), dinocap, dithianon, dithiolans, dodemorph, dodin, econazol, etaconazol, edifenphos, enoxastrobin (cũng được gọi là enestroburin), epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, etridiazol, famoxadon, fenamidon, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferimzon, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxystrobin, flumorph, fluopicolid, fluopyram, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamid, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fthalide (cũng được gọi là phthalide), fuberidazol, furalaxyl, furametpyr, hexaconazol, hymexazol, guazatin, imazalil, imibenconazol, iminoctadin albesilat, iminoctadin triaxetat, iodicarb, ipconazol, isofetamid, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb, isoprothiolan, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, mandestrobin, maneb, mapanipyrin, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl (bao gồm metalaxyl-M/mefenoxam), metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenon, myclobutanil, naftitine, neo-asozin (sắt (III) metanarsonat), nuarimol, oclthilidon, ofurace,

orysastrobin, oxadixyl, oxathiapiprolin, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, oxytetraxyclin, penconazol, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, perfurazoat, axit phosphor (bao gồm muối của nó, ví dụ fosetyl-nhôm), picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazol, prochloraz, procymidon, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazol, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributacarb, pyrifenox, pyriofenon, perisoxazol, pyrimethanil, pyrifenox, pyrrolnitrin, pyroquilon, quinconazol, quinmethionat, quinoxifen, quintozen, silthiofam, sedaxan, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, lưu huỳnh, tebuconazol, tebufloquin, tecloftalam, tecloftalam, tecnazen, terbinafine, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamit, thiophanat, thiophanat-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolprocarb, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, đồng tribazơ sulfat, triclopyricarb, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizol, trimopramit, trioxazolol, trifloxystrobin, triforin, triticonazol, uniconazol, validamycin, valifenalat (cũng được gọi là valifenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamit và 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidinyl]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]ethanon; chất diệt giun tròn, như fluopyram, spirotetramat, thiodicarb, fosthiazat, abamectin, iprodion, fluensulfon, dimetyl đisulfua, tioxazafen, 1,3-diclopropen (1,3-D), metam (natri và kali), dazomet, clopicrin, fenamiphos, ethoprophos, cadusaphos, terbufos, imicyafos, oxamyl, carbofuran, tioxazafen, *Bacillus firmus* và *Pasteuria nishizawae*; chất diệt khuẩn, như streptomycin; chất diệt ve, như amitraz, chinomethionat, clobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximat, hexythiazox, propargit, pyridaben và tebufenpyrad.

Theo một số phương án, việc kết hợp hợp chất theo sáng chế với hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học khác (đặc biệt là kiểm soát dịch hại không xương sống) (tức là hoạt chất) có thể tạo ra tác dụng hiệp đồng cộng. Việc giảm khối lượng hoạt chất giải phóng trong môi trường đồng thời đảm bảo hiệu quả kiểm soát dịch hại luôn được mong muốn. Khi tác dụng hiệp đồng của hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống xuất hiện ở các tỷ lệ bón tạo ra mức độ đáp ứng kiểm soát dịch hại không xương sống, việc kết hợp này có thể có lợi để làm giảm chi phí sản xuất cây trồng và làm giảm chất thải môi trường.

Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể được bón cho thực vật được chuyển gen để biểu hiện protein gây độc cho dịch hại không xương sống (như nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*). Phương pháp bón này có thể tạo ra phổ bảo vệ thực vật rộng hơn và có lợi để quản lý tính kháng. Tác dụng của hợp chất kiểm soát dịch hại không xương sống theo sáng chế được bón ngoại sinh có thể hiệp đồng với protein độc tố được biểu hiện.

Các chất bảo vệ nông nghiệp này (tức là chất diệt côn trùng, chất diệt nấm, chất diệt giun tròn, chất diệt ve, chất diệt cỏ và hoạt chất sinh học) được mô tả trong các tài liệu *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 và *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Khi một hoặc nhiều hợp chất bổ trợ này được sử dụng, thì tỷ lệ khối lượng của các hợp chất bổ trợ này so với hợp chất có công thức (1) nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1. Đặc biệt là tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này có thể dễ dàng xác định thông qua thử nghiệm đơn giản lượng hữu hiệu của hoạt chất cần thiết để tạo ra phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Đã biết rằng các thành phần bổ sung này có thể làm tăng phổ kiểm soát dịch hại không xương sống cao hơn phổ kiểm soát chỉ bởi hợp chất có công thức (1).

Bảng A thể hiện các chế phẩm kết hợp bao gồm hợp chất có công thức (1) với các hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống khác thể hiện hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp theo sáng chế. Cột thứ nhất của Bảng A thể hiện các hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống (ví dụ “abamectin” ở dòng thứ nhất). Cột thứ hai của Bảng A thể hiện cơ chế tác dụng (nếu đã biết) hoặc nhóm hóa học của các hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống. Cột thứ ba của Bảng A thể hiện các khoảng tỷ lệ khối lượng ở đó hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống có thể được bón cùng với hợp chất có công thức (1) (ví dụ “50:1 đến 1:50 khối lượng” abamectin cùng với hợp chất có công thức (1)). Do đó, ví dụ dòng thứ nhất của Bảng A thể hiện chế phẩm kết hợp bao gồm hợp chất có công thức (1) với abamectin có thể được bón ở tỷ lệ khối lượng nằm trong khoảng từ 50:1 đến 1:50. Các dòng còn lại của Bảng A được thể hiện tương tự. Đặc biệt là Bảng A thể hiện các chế phẩm kết hợp bao gồm hợp chất có công thức (1) với các hoạt

chất kiểm soát dịch hại không xương sống khác thể hiện hỗn hợp, chế phẩm và phương pháp theo sáng chế và các phương án bổ sung về khoảng tỷ lệ khối lượng đề bốn.

Bảng A

Hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống	Cơ chế tác dụng hoặc nhóm hóa học	Tỷ lệ khối lượng
Abamectin	chất hoạt hóa kênh clorua	50:1 đến 1:50
Axetamiprid	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	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
Azadirachtin	cơ chế tác dụng chưa biết	100:1 đến 1:120
Beta-cyfluthrin	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Bifenthrin	chất điều hòa kênh natri	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 nicotinic	100:1 đến 1:200
Chlorantraniliprol	chất điều hòa thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Chlorfenapyr	chất ngăn cản phosphoryl oxy hóa	300:1 đến 1:200
Chlorpyrifos	chất ức chế axetylcholinesteraza	500:1 đến 1:200
Clothianidin	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	100:1 đến 1:400
Cyantraniliprol	chất điều hòa thụ thể ryanodine	100:1 đến 1:120
Cyfluthrin	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Cyhalothrin	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Cypermethrin	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Cyromazin	chất gây rối loạn rụng lông ở côn trùng hai cánh	400:1 đến 1:50
Deltamethrin	chất điều hòa kênh natri	50:1 đến 1:400
Dieldrin	chất đối kháng kênh clorua được điều hòa bởi axit gama-aminobutyric	200:1 đến 1:100
Dinotefuran	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	150:1 đến 1:200
Diofenolan	chất có cấu trúc tương tự hormon kích thích sâu non	150:1 đến 1:200
Emamectin	chất hoạt hóa kênh clorua	50:1 đến 1:10
Endosulfan	chất đối kháng kênh clorua được điều hòa bởi axit gama-aminobutyric	200:1 đến 1:100
Esfenvalerat	chất điều hòa kênh natri	100:1 đến 1:400
Ethiprol	chất đối kháng kênh clorua được điều hòa bởi axit gama-aminobutyric	200:1 đến 1:100
Fenothiocarb		150:1 đến 1:200
Fenoxycarb	chất có cấu trúc tương tự hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Fenvalerat	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Fipronil	chất đối kháng kênh clorua được điều hòa bởi axit gama-aminobutyric	150:1 đến 1:100
Flonicamid	chất phong bế chọn lọc tập tính ăn của côn trùng cánh nửa	200:1 đến 1:100
Flubendiamit	chất điều hòa thụ thể ryanodine	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 hợp ty lạp thể III	150:1 đến 1:250
Imidacloprid	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	1000:1 đến 1:1000
Indoxacarb	chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện áp	200:1 đến 1:50
Lambda-cyhalothrin	chất điều hòa kênh natri	50:1 đến 1:250

Lufenuron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	500:1 đến 1:250
Metaflumizone	chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện áp	200:1 đến 1:200
Metomyl	chất ức chế axetylcholinesteraza	500:1 đến 1:100
Metopren	chất có cấu trúc tương tự hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Metoxyfenozit	chất chủ vận thụ thể ecdyson	50:1 đến 1:50
Nitenpyram	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	150:1 đến 1:200
Nithiazin	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	150:1 đến 1:200
Novaluron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	500:1 đến 1:150
Oxamyl	chất ức chế axetylcholinesteraza	200:1 đến 1:200
Pymetrozin	chất phong bế chọn lọc tập tính ăn của côn trùng cánh nửa	200:1 đến 1:100
Pyrethrin	chất điều hòa kênh natri	100:1 đến 1:10
Pyridaben	chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp ty lạp thể I	200:1 đến 1:100
Pyridalyl	cơ chế tác dụng chưa biết	200:1 đến 1:100
Pyriproxyfen	chất có cấu trúc tương tự hormon kích thích sâu non	500:1 đến 1:100
Ryanodin	phối tử thụ thể ryanodin	100:1 đến 1:120
Spinetoram	chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể axetylcholin nicotinic	150:1 đến 1:100
Spinosad	chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể axetylcholin nicotinic	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 nicotinic	100:1 đến 1:200
Thiametoxam	chất chủ vận thụ thể axetylcholin nicotinic	1250:1 đến 1:1000
Thiodicarb	chất ức chế axetylcholinesteraza	500:1 đến 1:400
Thiosultap-natri	chất phong bế kênh thụ thể axetylcholin nicotinic	150:1 đến 1:100
Tralomethrin	chất điều hòa kênh natri	150:1 đến 1:200
Triazamat	chất ức chế axetylcholinesteraza	250:1 đến 1:100
Triflumezopyrim		
Triflumuron	chất ức chế sinh tổng hợp kitin	200:1 đến 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	hoạt chất sinh học	50:1 đến 1:10
Nội độc tố delta <i>Bacillus thuringiensis</i>	hoạt chất sinh học	50:1 đến 1:10
Virut nhiều hạt (ví dụ Gemstar)	hoạt chất sinh học	50:1 đến 1:10

Đặc biệt là chế phẩm theo sáng chế, trong đó ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ các hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống được thể hiện trong Bảng nêu trên.

Tỷ lệ khối lượng của hợp chất, bao gồm hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó, so với hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung thông thường nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000, theo một phương án nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, theo một phương án khác nằm trong khoảng từ 250:1 đến 1:200 và theo một phương án khác nằm trong khoảng từ 100:1 đến 1:50.

Chế phẩm chứa hợp chất có công thức (1) (chỉ số hợp chất liên quan đến các hợp chất trong Bảng chỉ số A) và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung được thể hiện trong Bảng B1 đến B8.

Bảng B1

Hỗn hợp	Hợp chất	và	Hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống	Hỗn hợp	Hợp chất	và	Hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống
B1-1	2	và	Abamectin	B1-38	2	và	Indoxacarb
B1-2	2	và	Axetamiprid	B1-39	2	và	Lamda-cyhalothrin
B1-3	2	và	Amitraz	B1-40	2	và	Lufenuron
B1-4	2	và	Avermectin	B1-41	2	và	Metaflumizone
B1-5	2	và	Azadirachtin	B1-42	2	và	Metomyl
B1-6	2	và	Bensultap	B1-43	2	và	Metopren
B1-7	2	và	Beta-cyfluthrin	B1-44	2	và	Metoxyfenozit
B1-8	2	và	Bifenthrin	B1-45	2	và	Nitenpyram
B1-9	2	và	Buprofezin	B1-46	2	và	Nithiazin
B1-10	2	và	Cartap	B1-47	2	và	Novaluron
B1-11	2	và	Chlorantraniliprol	B1-48	2	và	Oxamyl
B1-12	2	và	Chlorfenapyr	B1-49	2	và	Phosmet
B1-13	2	và	Chlorpyrifos	B1-50	2	và	Pymetrozin
B1-14	2	và	Clothianidin	B1-51	2	và	Pyrethrin
B1-15	2	và	Cyantraniliprol	B1-52	2	và	Pyridaben
B1-16	2	và	Cyfluthrin	B1-53	2	và	Pyridalyl
B1-17	2	và	Cyhalothrin	B1-54	2	và	Pyriproxyfen
B1-18	2	và	Cypermethrin	B1-55	2	và	Ryanodin
B1-19	2	và	Cyromazin	B1-56	2	và	Spinetoram
B1-20	2	và	Deltamethrin	B1-57	2	và	Spinosad
B1-21	2	và	Dieldrin	B1-58	2	và	Spirodiclofen
B1-22	2	và	Dinotefuran	B1-59	2	và	Spiromesifen
B1-23	2	và	Diofenolan	B1-60	2	và	Spirotetramat
B1-24	2	và	Emamectin	B1-61	2	và	Sulfoxaflor
B1-25	2	và	Endosulfan	B1-62	2	và	Tebufenozit
B1-26	2	và	Esfenvalerat	B1-63	2	và	Tefluthrin
B1-27	2	và	Ethiprol	B1-64	2	và	Thiacloprid
B1-28	2	và	Fenothiocarb	B1-65	2	và	Thiametoxam
B1-29	2	và	Fenoxycarb	B1-66	2	và	Thiodicarb
B1-30	2	và	Fenvalerat	B1-67	2	và	Thiosultap-natri
B1-31	2	và	Fipronil	B1-68	2	và	Tolfenpyrad
B1-32	2	và	Flonicamid	B1-69	2	và	Tralomethrin
B1-33	2	và	Flubendiamit	B1-70	2	và	Triazamat
B1-34	2	và	Flufenoxuron	B1-71	2	và	Triflumezopyrim
B1-35	2	và	Hexaflumuron	B1-72	2	và	Triflumuron
B1-36	2	và	Hydrametylnon	B1-73	2	và	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-37	2	và	Imidacloprid	B1-74	2	và	Nội độc tố delta <i>Bacillus thuringiensis</i>
				B1-75	2	và	Virut nhiều hạt (ví dụ Gemstar)

Bảng B2

Bảng B2 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 32. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B2 được ký hiệu là B2-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 32 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B3

Bảng B3 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 42. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B3 được ký hiệu là B3-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 42 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B4

Bảng B4 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 48. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B4 được ký hiệu là B4-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 48 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B5

Bảng B5 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B5 được ký hiệu là B5-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 54 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B6

Bảng B6 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 59. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B6 được ký hiệu là B6-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 59 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B7

Bảng B7 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 84. Ví dụ, hỗn hợp thứ

nhất trong Bảng B7 được ký hiệu là B7-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 84 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Bảng B8

Bảng B8 là giống hệt với Bảng B1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 85. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng B8 được ký hiệu là B8-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 85 và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung abamectin.

Hỗn hợp được thể hiện trong Bảng B1 đến B8 thông thường kết hợp hợp chất có công thức (1) với hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống khác ở tỷ lệ được thể hiện trong Bảng A.

Hỗn hợp chứa hợp chất có công thức (1) (chỉ số hợp chất liên quan đến hợp chất trong Bảng chỉ số A) và hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống bổ sung được thể hiện trong Bảng C1 đến C8. Bảng C1 đến C8 cũng thể hiện tỷ lệ khối lượng của hỗn hợp trong Bảng C1 đến C8. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C1 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 2 của Bảng chỉ số A và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 2 so với 1 phần abamectin.

Bảng C1

Hỗn hợp	Hợp chất	và	Hoạt chất kiểm soát dịch hại không xương sống	Tỷ lệ khối lượng								
C1-1	2	và	Abamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-2	2	và	Axetamiprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-3	2	và	Amitraz	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-4	2	và	Avermectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-5	2	và	Azadirachtin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-6	2	và	Bensultap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-7	2	và	Beta-cyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-8	2	và	Bifenthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-9	2	và	Buprofezin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-10	2	và	Cartap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-11	2	và	Chlorantraniliprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-12	2	và	Chlorfenapyr	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-13	2	và	Chlorpyrifos	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-14	2	và	Clothianidin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-15	2	và	Cyantraniliprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-16	2	và	Cyfluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-17	2	và	Cyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-18	2	và	Cypermethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-19	2	và	Cyromazin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-20	2	và	Deltamethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	2	và	Dieldrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	2	và	Dinotefuran	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	2	và	Diofenolan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	2	và	Emamectin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	2	và	Endosulfan	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	2	và	Esfenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	2	và	Ethiprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	2	và	Fenothiocarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	2	và	Fenoxycarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	2	và	Fenvalerat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	2	và	Fipronil	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	2	và	Flonicamid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	2	và	Flubendiamit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	2	và	Flufenoxuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	2	và	Hexaflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	2	và	Hydrametylnon	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	2	và	Imidacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	2	và	Indoxacarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	2	và	Lamda-cyhalothrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	2	và	Lufenuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	2	và	Metaflumizone	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	2	và	Metomyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	2	và	Metopren	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	2	và	Metoxyfenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	2	và	Nitenpyram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	2	và	Nithiazin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	2	và	Novaluron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	2	và	Oxamyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	2	và	Phosmet	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	2	và	Pymetrozin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	2	và	Pyrethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	2	và	Pyridaben	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	2	và	Pyridalyl	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	2	và	Pyriproxyfen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	2	và	Ryanodín	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	2	và	Spinetoram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	2	và	Spinosad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	2	và	Spirodiclofen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	2	và	Spiromesifen	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	2	và	Spirotetramat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	2	và	Sulfoxaflor	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	2	và	Tebufenozit	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	2	và	Tefluthrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	2	và	Thiacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	2	và	Thiametoxam	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-66	2	và	Thiodicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	2	và	Thiosultap-natri	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	2	và	Tolfenpyrad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	2	và	Tralomethrin	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	2	và	Triazamat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	2	và	Triflumezopyrim	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	2	và	Triflumuron	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	2	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	2	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	2	và	Virut nhiều hạt (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 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 32. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C2 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 32 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 32 so với 1 phần abamectin.

Bảng C3

Bảng C3 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 42. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C3 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 42 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 42 so với 1 phần abamectin.

Bảng C4

Bảng C4 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 48. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C4 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 48 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 48 so với 1 phần abamectin.

Bảng C5

Bảng C5 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 54. Ví dụ, cột tỷ lệ

khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C5 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 54 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 54 so với 1 phần abamectin.

Bảng C6

Bảng C6 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 59. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C6 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 59 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 59 so với 1 phần abamectin.

Bảng C7

Bảng C7 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 84. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C7 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 84 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 84 so với 1 phần abamectin.

Bảng C8

Bảng C8 là giống hệt với Bảng C1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 85. Ví dụ, cột tỷ lệ khối lượng thứ nhất của dòng thứ nhất của Bảng C8 thể hiện hỗn hợp chứa hợp chất 85 và abamectin được bón ở tỷ lệ khối lượng là 100 phần hợp chất 85 so với 1 phần abamectin.

Chế phẩm chứa hợp chất có công thức (1) (chỉ số hợp chất liên quan đến hợp chất trong Bảng chỉ số A) và chất diệt nấm bổ sung được thể hiện trong Bảng D1 đến D8.

Bảng D1

Hỗn hợp	Hợp chất	và	Chất diệt nấm	Hỗn hợp	Hợp chất	và	Chất diệt nấm
D1-1	2	và	Probenazol	D1-17	2	và	Difenoconazol
D1-2	2	và	Tiadinil	D1-18	2	và	Cyproconazol
D1-3	2	và	Isotianil	D1-19	2	và	Propiconazol
D1-4	2	và	Pyroquilon	D1-20	2	và	Fenoxanil
D1-5	2	và	Metominostrobin	D1-21	2	và	Ferimzon
D1-6	2	và	Flutolanil	D1-22	2	và	Fthalide
D1-7	2	và	Validamycin	D1-23	2	và	Kasugamycin
D1-8	2	và	Furametpyr	D1-24	2	và	Picoxystrobin
D1-9	2	và	Pencycuron	D1-25	2	và	Penthiopyrad

Hỗn hợp	Hợp chất	và	Chất diệt nấm	Hỗn hợp	Hợp chất	và	Chất diệt nấm
D1-10	2	và	Simeconazol	D1-26	2	và	Famoxadon
D1-11	2	và	Orysastrobilin	D1-27	2	và	Cymoxanil
D1-12	2	và	Trifloxystrobin	D1-28	2	và	Proquinazid
D1-13	2	và	Isoprothiolan	D1-29	2	và	Flusilazol
D1-14	2	và	Azoxystrobin	D1-30	2	và	Mancozeb
D1-15	2	và	Trioxyclozol	D1-31	2	và	Đồng hydroxit
D1-16	2	và	Hexaconazol	D1-32	2	và	Oxathiapiprolin

Bảng D2

Bảng D2 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 32. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D2 được ký hiệu là D2-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 32 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D3

Bảng D3 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 42. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D3 được ký hiệu là D3-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 42 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D4

Bảng D4 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 48. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D4 được ký hiệu là D4-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 48 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D5

Bảng D5 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 54. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D5 được ký hiệu là D5-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 54 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D6

Bảng D6 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 59. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D6 được ký hiệu là D6-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 59 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D7

Bảng D7 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 84. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D7 được ký hiệu là D7-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 84 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Bảng D8

Bảng D8 là giống hệt với Bảng D1, chỉ khác là mỗi chỉ số liên quan đến hợp chất 2 trong cột “hợp chất” được thay bằng chỉ số liên quan đến hợp chất 85. Ví dụ, hỗn hợp thứ nhất trong Bảng D8 được ký hiệu là D8-1 và là hỗn hợp chứa hợp chất 85 và chất diệt nấm bổ sung probenazol.

Dịch hại không xương sống được kiểm soát trong môi trường nông nghiệp và phi nông nghiệp bằng cách bón một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, thông thường ở dạng chế phẩm, ở lượng hữu hiệu, vào môi trường sinh sống của dịch hại, bao gồm môi trường nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp bị lây nhiễm, khu vực cần bảo vệ, hoặc trực tiếp lên dịch hại cần kiểm soát.

Do đó, sáng chế đề xuất phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống trong môi trường nông nghiệp và/hoặc phi nông nghiệp, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với với lượng hữu hiệu của một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, hoặc chế phẩm trừ dịch hại, chứa ít nhất một hợp chất này hoặc chế phẩm trừ dịch hại, chứa ít nhất một hợp chất này và lượng hữu hiệu của ít nhất một hoạt chất hoặc hợp 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 của ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung bao gồm chế phẩm dạng cốm, trong đó hoạt chất bổ sung có mặt trong cùng chế phẩm dạng cốm như hợp chất theo sáng chế hoặc trong chế phẩm dạng cốm riêng biệt với chế phẩm dạng cốm chứa hợp chất theo sáng chế.

Để tiếp xúc được với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi dịch hại không xương sống, hợp chất hoặc chế phẩm thường được bón vào hạt giống của cây trồng này trước khi trồng, tán lá (ví dụ lá, thân, hoa, quả) của cây trồng, hoặc đất hoặc môi trường sinh trưởng khác trước hoặc sau khi cây trồng này được trồng.

Theo một phương án, phương pháp tiếp xúc bao gồm bước phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng cốm chứa hợp chất theo sáng chế có thể bón vào tán lá hoặc đất. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được phân bố hiệu quả thông qua quá trình hấp thu của thực vật bằng cách cho thực vật tiếp xúc với chế phẩm trừ dịch hại, chứa hợp chất theo sáng chế được bón dưới dạng chế phẩm tưới đất dạng lỏng, chế phẩm dạng cốm để bón cho đất, chế phẩm xử lý chậu ươm hoặc chế phẩm nhúng cây con. Đặc biệt là chế phẩm theo sáng chế ở dạng chế phẩm dạng lỏng tưới đất. Cũng đặc biệt là phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất theo sáng chế hoặc chế phẩm trừ dịch hại, chứa lượng hữu hiệu của hợp chất theo sáng chế. Đặc biệt là phương pháp, trong đó môi trường này là đất và chế phẩm được bón vào đất dưới dạng chế phẩm tưới đất. Đặc biệt là hợp chất theo sáng chế cũng hữu hiệu khi được bón khu trú vào khu vực lây nhiễm. Các phương pháp tiếp xúc khác bao gồm việc bón hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế bằng chế phẩm phun trực tiếp và phun dư, chế phẩm phun từ trên cao, gel, chế phẩm phủ hạt, chế phẩm vi nang, chế phẩm hấp thu toàn thân, chế phẩm thuốc mồi, thẻ đeo tai, chế phẩm dùng một lần, chế phẩm phun mù, thuốc hun, chế phẩm phun sương, chế phẩm rắc và nhiều chế phẩm khác. Theo một phương án, phương pháp tiếp xúc bao gồm việc bón chế phẩm phân bón dạng cốm ổn định, chế phẩm dính hoặc viên nén chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể tẩm vào vật liệu để chế tạo thiết bị kiểm soát dịch không xương sống (ví dụ lưới ngăn côn trùng).

Hợp chất theo sáng chế hữu ích trong xử lý toàn bộ thực vật, bộ phận thực vật và hạt giống. Các loài và giống thực vật và hạt giống có thể được thu nhận bằng phương pháp nhân giống và gieo trồng thông thường hoặc bằng các phương pháp thiết kế di truyền. Thực vật hoặc hạt giống được cải biến di truyền (thực vật chuyển gen hoặc hạt giống chuyển gen) là thực vật hoặc hạt giống trong đó gen không tương đồng (gen chuyển) đã được tích hợp ổn định vào bộ gen của thực vật hoặc hạt giống. Gen chuyển được xác định bằng vị trí cụ thể của nó trong bộ gen thực vật được gọi là gen biến nạp hoặc gen chuyển ổn định.

Các giống thực vật và hạt giống được cải biến di truyền có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm thực vật và hạt giống có khả năng kháng một hoặc nhiều điều kiện khắc nghiệt có nguồn gốc sinh học (dịch hại, như giun tròn, côn trùng, bét, vi nấm, v.v)

hoặc điều kiện khắc nghiệt có nguồn gốc phi sinh học (hạn hán, nhiệt độ lạnh, độ mặn của đất, v.v), hoặc chứa các đặc tính mong muốn khác. Thực vật và hạt giống có thể được cải biến di truyền để biểu hiện các tính trạng, ví dụ khả năng chống chịu chất diệt cỏ, tính kháng côn trùng, hàm lượng dầu được cải thiện hoặc khả năng chịu hạn. Thực vật và hạt giống được cải biến di truyền hữu ích chứa một hoặc nhiều gen chuyển được thể hiện trong Bảng Z. Thông tin bổ sung về các phương pháp cải biến di truyền được thể hiện trong Bảng Z có thể thu được từ các cơ sở dữ liệu sau:

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

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

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

Các ký hiệu viết tắt được sử dụng trong Bảng Z bao gồm SU là sulfonylure, ALS là axetolactat synthaza, HPPD là 4-hydroxyphenylpyruvat dioxyaza, NA là không có sẵn?.

Bảng Z

Cây trồng	Gen chuyển	Mã gen chuyển	Tính trạng	Gen
Cỏ linh lăng	J101	MON-00101-8	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cỏ linh lăng	J163	MON-ØØ163-7	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cải dầu*	23-18-17 (gen chuyển 18)	CGN-89465-2	Hàm lượng dầu axit lauric cao	te
Cải dầu*	23-198 (gen chuyển 23)	CGN-89465-2	Hàm lượng dầu axit lauric cao	te
Cải dầu*	61061	DP-Ø61Ø61-7	Khả năng chống chịu glyphosat	gat4621
Cải dầu*	73496	DP-Ø73496-4	Khả năng chống chịu glyphosat	gat4621
Cải dầu*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải dầu*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải dầu*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	Khả năng chống chịu glufosinat	pat (syn)
Cải dầu*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	MON88302	MON-883Ø2-9	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Cải dầu*	MPS961	NA	Chuyển hóa phytat	phyA
Cải dầu*	MPS962	NA	Chuyển hóa phytat	phyA
Cải dầu*	MPS963	NA	Chuyển hóa phytat	phyA

Cải dầu*	MPS964	NA	Chuyển hóa phytat	phyA
Cải dầu*	MPS965	NA	Chuyển hóa phytat	phyA
Cải dầu*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	MS8	ACS-BNØØ5-8	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	Khả năng chống chịu oxynil	bxn
Cải dầu*	PHY14	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	PHY23	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	PHY35	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	PHY36	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Cải dầu*	RF3	ACS-BNØØ3-6	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Đậu	EMBRAPA 5,1	EMB-PV051-1	Tính kháng dịch bệnh	ac1 (không dùng làm khuôn và dùng làm khuôn)
Cà tím	EE-1		Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Cẩm chướng	11 (7442)	FLO-07442-4	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cẩm chướng	11363 (1363A)	FLO-11363-1	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	1226A (11226)	FLO-11226-8	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	123.2.2 (40619)	FLO-4Ø619-7	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cẩm chướng	123.2.38 (40644)	FLO-4Ø644-4	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cẩm chướng	123.8.12	FLO-4Ø689-6	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	123.8.8 (40685)	FLO-4Ø685-1	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	1351A (11351)	FLO-11351-7	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	1400A (11400)	FLO-114ØØ-2	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cẩm chướng	15	FLO-ØØØ15-2	Khả năng chống chịu sulfonyle; màu sắc	surB; dfr; hfl (f3'5'h)

			hoa được biến đổi	
Cắm chướng	16	FLO-00016-3	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cắm chướng	4	FLO-00004-9	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Cắm chướng	66	FLO-00066-8	Khả năng chống chịu sulfonyleure; lâu già cỗi	surB; acc
Cắm chướng	959A (11959)	FLO-11959-3	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cắm chướng	988A (11988)	FLO-11988-7	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cắm chướng	26407	IFD-26497-2	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Cắm chướng	25958	IFD-25958-3	Khả năng chống chịu sulfonyleure; màu sắc hoa được biến đổi	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Rau diếp xoăn	RM3-3	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-4	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Rau diếp xoăn	RM3-6	NA	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Bông	19-51a	DD-01951A-7	Khả năng chống chịu chất diệt cỏ ức chế acetolactat synthaza	S4-HrA
Bông	281-24-236	DAS-24236-5	Khả năng chống chịu glufosinat; tính kháng côn trùng	pat (syn); cry1F
Bông	3006-210-23	DAS-21023-5	Khả năng chống chịu glufosinat; tính kháng côn trùng	pat (syn); cry1Ac
Bông	31707	NA	Khả năng chống chịu oxynil; tính kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31803	NA	Khả năng chống chịu oxynil; tính kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31807	NA	Khả năng chống chịu oxynil; tính kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	31808	NA	Khả năng chống chịu oxynil; tính kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	42317	NA	Khả năng chống chịu oxynil; tính kháng côn trùng	bxn; cry1Ac
Bông	BNLA-601	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	BXN10211	BXN10211-9	Khả năng chống chịu oxynil	bxn; cry1Ac

Bông	BXN10215	BXN10215-4	Khả năng chống chịu oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	BXN10222	BXN10222-2	Khả năng chống chịu oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	BXN10224	BXN10224-4	Khả năng chống chịu oxynil	bxn; cry1Ac
Bông	COT102	SYN-IR102-7	Tính kháng côn trùng	vip3A(a)
Bông	COT67B	SYN-IR67B-1	Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	COT202		Tính kháng côn trùng	vip3A
Bông	Event 1	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Tính kháng côn trùng	cry1Ab-Ac
Bông	GHB119	BCS-GH005-8	Tính kháng côn trùng	cry2Ae
Bông	GHB614	BCS-GH002-5	Khả năng chống chịu glyphosat	2mepsps
Bông	GK12	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ab-Ac
Bông	LLBông25	ACS-GH001-3	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Bông	MLS 9124	NA	Tính kháng côn trùng	cry1C
Bông	MON1076	MON-89924-2	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON1445	MON-01445-2	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	MON15985	MON-15985-7	Tính kháng côn trùng	cry1Ac; cry2Ab2
Bông	MON1698	MON-89383-1	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	MON531	MON-00531-6	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON757	MON-00757-7	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Bông	MON88913	MON-88913-8	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	Nqwe Chi 6 Bt	NA	Tính kháng côn trùng	NA?
Bông	SKG321	NA	Tính kháng côn trùng	cry1A; CpTI
Bông	T303-3	BCS-GH003-6	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ab; bar
Bông	T304-40	BCS-GH004-7	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ab; bar
Bông	CE43-67B		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	CE46-02A		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	CE44-69D		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	1143-14A		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	1143-51B		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	T342-142		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	PV-GHGT07 (1445)		Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bông	EE-GH3		Khả năng chống chịu glyphosat	mepsps
Bông	EE-GH5		Tính kháng côn trùng	cry1Ab
Bông	MON88701	MON-88701-3	Khả năng chống chịu glufosinat và dicamba	dmo cải biến; bar

Bông	OsCR11		Chống dị ứng	Cry j cải biến
Creeping Bentgrass	ASR368	SMG-368ØØ-2	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bạch đàn	20-C		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn	12-5C		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn	12-5B		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn	107-1		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn	1/9/2001		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn	2/1/2001		Khả năng chịu mặn	codA
Bạch đàn			Khả năng chịu lạnh	des9
Lanh	FP967	CDC-FL001-2	Khả năng chống chịu chất diệt cỏ ức chế acetolactat synthaza	als
Đậu lăng	RH44		Khả năng chống chịu imidazolinon	als
Bắp	3272	SYN-E3272-5	Modified alpha-amylase	amy797E
Bắp	5307	SYN-05307-1	Tính kháng côn trùng	ecry3.1Ab
Bắp	59122	DAS-59122-7	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	676	PH-000676-7	Khả năng chống chịu glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	678	PH-000678-9	Khả năng chống chịu glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	680	PH-000680-2	Khả năng chống chịu glufosinat; kiểm soát thụ phấn	pat; dam
Bắp	98140	DP-098140-6	Khả năng chống chịu glyphosat; khả năng chống chịu chất diệt cỏ ức chế acetolactat synthaza	gat4621; zm-hra
Bắp	Bt10	NA	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ab; pat
Bắp	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ab; bar
Bắp	BVLA430101	NA	Chuyển hóa phytat	phyA2
Bắp	CBH-351	ACS-ZM004-3	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry9C; bar
Bắp	DAS40278-9	DAS40278-9	khả năng chống chịu 2,4-D	aad-1
Bắp	DBT418	DKB-89614-9	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ac; pinII; bar
Bắp	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Bắp	GA21	MON-00021-9	Khả năng chống chịu	mepsps

			glyphosat	
Bắp	GG25		Khả năng chống chịu glyphosat	mepsps
Bắp	GJ11		Khả năng chống chịu glyphosat	mepsps
Bắp	FI117		Khả năng chống chịu glyphosat	mepsps
Bắp	GAT-ZM1		Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Bắp	LY038	REN-00038-3	Hàm lượng lysin tăng	cordapA
Bắp	MIR162	SYN-IR162-4	Tính kháng côn trùng	vip3Aa20
Bắp	MIR604	SYN-IR604-5	Tính kháng côn trùng	mcry3A
Bắp	MON801 (MON80100)	MON801	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON802	MON-80200-7	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON809	PH-MON-809-2	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON810	MON-00810-6	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glyphosat	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON832	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Bắp	MON863	MON-00863-5	Tính kháng côn trùng	cry3Bb1
Bắp	MON87427	MON-87427-7	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	MON87460	MON-87460-4	Khả năng chịu hạn	cspB
Bắp	MON88017	MON-88017-3	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glyphosat	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	MON89034	MON-89034-3	Tính kháng côn trùng	cry2Ab2; cry1A.105
Bắp	MS3	ACS-ZM001-9	Khả năng chống chịu glufosinat; kiểm soát thụ phấn	bar; barnase
Bắp	MS6	ACS-ZM005-4	Khả năng chống chịu glufosinat; kiểm soát thụ phấn	bar; barnase
Bắp	NK603	MON-00603-6	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Bắp	T14	ACS-ZM002-1	Khả năng chống chịu glufosinat	pat (syn)
Bắp	T25	ACS-ZM003-2	Khả năng chống chịu glufosinat	pat (syn)
Bắp	TC1507	DAS-01507-1	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1Fa2; pat
Bắp	TC6275	DAS-06275-8	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	mocry1F; bar
Bắp	VIP1034		Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu	vip3A; pat

			glufosinat	
Bắp	43A47	DP-043A47-3	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	40416	DP-040416-8	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	32316	DP-032316-8	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Bắp	4114	DP-004114-3	Tính kháng côn trùng; khả năng chống chịu glufosinat	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Dưa	Dưa A	NA	Lâu chín/già cỗi	sam-k
Dưa	Dưa B	NA	Lâu chín/già cỗi	sam-k
Đu đủ	55-1	CUH-CP551-8	Tính kháng dịch bệnh	prsv cp
Đu đủ	63-1	CUH-CP631-7	Tính kháng dịch bệnh	prsv cp
Đu đủ	Huanong số 1	NA	Tính kháng dịch bệnh	prsv rep
Đu đủ	X17-2	UFL-X17CP-6	Tính kháng dịch bệnh	prsv cp
Dã yên thảo	Dã yên thảo-CHS	NA	Chất lượng sản phẩm được cải thiện	CHS ức chế
Mận	C-5	ARS-PLMC5-6	Tính kháng dịch bệnh	ppv cp
Cải dầu**	ZSR500	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải dầu**	ZSR502	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải dầu**	ZSR503	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cây dương	Cây dương chuyển gen Bt	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ac; API
Cây dương	Dòng cây dương lai 741	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ac; API
Cây dương	trg300-1		Hàm lượng xenluloza cao	AaXEG2
Cây dương	trg300-2		Hàm lượng xenluloza cao	AaXEG2
Khoai tây	1210 amk	NA	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	2904/1 kgs	NA	Tính kháng côn trùng	cry3A
Cải dầu**	ZSR500	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Cải dầu**	ZSR502	NA	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Khoai tây	ATBT04-27	NMK-89367-8	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-30	NMK-89613-2	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-31	NMK-89170-9	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-36	NMK-89279-1	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	ATBT04-6	NMK-89761-6	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT06	NMK-89812-3	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT10	NMK-89175-5	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT12	NMK-89601-8	Tính kháng côn trùng	cry3A

Khoai tây	BT16	NMK-89167-6	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT17	NMK-89593-9	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT18	NMK-89906-7	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	BT23	NMK-89675-1	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	EH92-527-1	BPS-25271-9	Hàm lượng tinh bột/carbohydrat được cải thiện	gbss (dùng làm khuôn))
Khoai tây	HLMT15-15	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-3	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	HLMT15-46	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT15-101	NMK-89653-6	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	RBMT21-129	NMK-89684-1	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-152	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT21-350	NMK-89185-6	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Khoai tây	RBMT22-082	NMK-89896-6	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh; khả năng chống chịu glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-186	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh; khả năng chống chịu glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-238	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh; khả năng chống chịu glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	RBMT22-262	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh; khả năng chống chịu glyphosat	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Khoai tây	SEMT15-02	NMK-89935-9	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-07	NA	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SEMT15-15	NMK-89930-4	Tính kháng côn trùng và dịch bệnh	cry3A; pvy cp
Khoai tây	SPBT02-5	NMK-89576-1	Tính kháng côn trùng	cry3A
Khoai tây	SPBT02-7	NMK-89724-5	Tính kháng côn trùng	cry3A
Lúa	7Crp#242-95-7		Chống dị ứng	7crp
Lúa	7Crp#10	NA	Chống dị ứng	7crp
Lúa	GM Shanyou 63	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ab; cry1Ac
Lúa	Huahui-1/TT51-1	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ab; cry1Ac
Lúa	LLRICE06	ACS-OS001-4	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Lúa	LLRICE601	BCS-OS003-7	Khả năng chống chịu glufosinat	bar

Lúa	LLRICE62	ACS-OS002-5	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Lúa	Tarom molaii + cry1Ab	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ab (cắt ngắn)
Lúa	GAT-OS2		Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Lúa	GAT-OS3		Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Lúa	PE-7		Tính kháng côn trùng	Cry1Ac
Lúa	7Crp#10	NA	Chống dị ứng	7crp
Lúa	KPD627-8		Hàm lượng tryptophan cao	OASA1D
Lúa	KPD722-4		Hàm lượng tryptophan cao	OASA1D
Lúa	KA317		Hàm lượng tryptophan cao	OASA1D
Lúa	HW5		Hàm lượng tryptophan cao	OASA1D
Lúa	HW1		Hàm lượng tryptophan cao	OASA1D
Lúa	B-4-1-18		Lúa lùn lá thẳng	Δ OsBRI1
Lúa	G-3-3-22		Lúa lùn	OSGA2ox1
Lúa	AD77		Tính kháng dịch bệnh	DEF
Lúa	AD51		Tính kháng dịch bệnh	DEF
Lúa	AD48		Tính kháng dịch bệnh	DEF
Lúa	AD41		Tính kháng dịch bệnh	DEF
Lúa	13pNasNaatAprt1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
Lúa	13pAprt1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	APRT
Lúa	gHvNAS1-gHvNAAT-1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
Lúa	gHvIDS3-1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	HvIDS3
Lúa	gHvNAAT1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	HvNAAT-A; HvNAAT-B
Lúa	gHvNAS1-1		Khả năng chống chịu điều kiện hàm lượng sắt thấp	HvNAS1
Lúa	NIA-OS006-4		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS005-3		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS004-2		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS003-1		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS002-9		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	NIA-OS001-8		Tính kháng dịch bệnh	WRKY45
Lúa	OsCR11		Chống dị ứng	Cry j cải biến

Lúa	17053		Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Lúa	17314		Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Hoa hồng	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	Màu sắc hoa được biến đổi	5AT; bp40 (f3'5'h)
Hoa hồng	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	Màu sắc hoa được biến đổi	5AT; bp40 (f3'5'h)
Đậu tương	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	Hàm lượng dầu/axit béo được cải thiện	gm-fad2-1 (cụm gen lặn)
Đậu tương	A2704-12	ACS-GM005-3	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	A2704-21	ACS-GM004-2	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	A5547-127	ACS-GM006-4	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	A5547-35	ACS-GM008-6	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	CV127	BPS-CV127-9	Khả năng chống chịu imidazolinon	csr1-2
Đậu tương	DAS68416-4	DAS68416-4	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	DP305423	DP-305423-1	Hàm lượng dầu/axit béo được cải thiện; khả năng chống chịu chất diệt cỏ ức chế acetolactat synthaza	gm-fad2-1 (cụm gen lặn); gm-hra
Đậu tương	DP356043	DP-356043-5	Hàm lượng dầu/axit béo được cải thiện; khả năng chống chịu glyphosat	gm-fad2-1 (cụm gen lặn); gat4601
Đậu tương	FG72	MST-FG072-3	Khả năng chống chịu glyphosat và chất ức chế 4-hydroxyphenylpyruvat dioxyaza	2mepsps; hppdPF W336
Đậu tương	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	GU262	ACS-GM003-1	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Đậu tương	MON87701	MON-87701-2	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Đậu tương	MON87705	MON-87705-6	Hàm lượng dầu/axit béo được cải thiện; khả năng chống chịu glyphosat	fatb1-A (không dùng làm khuôn và dùng làm khuôn); fad2-1A (không dùng làm khuôn và dùng làm khuôn); cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON87708	MON-87708-9	Khả năng chống chịu glyphosat và dicamba	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON87769	MON-87769-7	Hàm lượng dầu/axit béo được cải thiện; khả năng chống chịu glyphosat	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
Đậu tương	MON89788	MON-89788-1	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)

Đậu tương	W62	ACS-GM002-9	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Đậu tương	W98	ACS-GM001-8	Khả năng chống chịu glufosinat	bar
Đậu tương	MON87754	MON-87754-1	Hàm lượng dầu cao	dgat2A
Đậu tương	DAS21606	DAS-21606	Khả năng chống chịu glufosinat và aryloxyalkanoat	aad-12 cải biến; pat
Đậu tương	DAS44406	DAS-44406-6	Khả năng chống chịu glufosinat; aryloxyalkanoat, và glyphosat	aad-12 cải biến; 2mepsps; pat
Đậu tương	SYHT04R	SYN-0004R-8	Khả năng chống chịu mesotrion	avhppd cải biến
Đậu tương	9582.814.19.1		Tính kháng côn trùng và khả năng chống chịu glufosinat	cry1Ac, cry1F, PAT
Bí	CZW3	SEM-ØCZW3-2	Tính kháng dịch bệnh	cmv cp, zymv cp, wmv cp
Bí	ZW20	SEM-ØZW20-7	Tính kháng dịch bệnh	zymv cp, wmv cp
Củ cải đường	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Củ cải đường	H7-1	KM-000H71-4	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Củ cải đường	T120-7	ACS-BV001-3	Khả năng chống chịu glufosinat	pat
Củ cải đường	T227-1		Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
Mía	NXI-1T		Khả năng chịu hạn	EcbetA
Hướng dương	X81359		Khả năng chống chịu imidazolinon	als
Ớt chuông	PK-SP01	NA	Tính kháng dịch bệnh	cmv cp
Thuốc lá	C/F/93/08-02	NA	Khả năng chống chịu oxynil	bxn
Thuốc lá	Vector 21-41	NA	Hàm lượng nicotin giảm	NtQPT1 (dùng làm khuôn))
Cà chua	1345-4	NA	Lâu chín/già cỗi	acc (cắt ngắn)
Cà chua	35-1-N	NA	Lâu chín/già cỗi	sam-k
Cà chua	5345	NA	Tính kháng côn trùng	cry1Ac
Cà chua	8338	CGN-89322-3	Lâu chín/già cỗi	accd
Cà chua	B	SYN-0000B-6	Lâu chín/già cỗi	pg (không dùng làm khuôn hoặc dùng làm khuôn)
Cà chua	Da	SYN-0000DA-9	Lâu chín/già cỗi	pg (không dùng làm khuôn hoặc dùng làm khuôn)
Hướng dương	X81359		Khả năng chống chịu imidazolinon	als
Cà chua	Da Dong No 9	NA	Sản phẩm được cải thiện	NA
Cà chua	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	Lâu chín/già cỗi	pg (không dùng làm khuôn hoặc dùng làm khuôn)

Cà chua	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Lâu chín/già cỗi	pg (không dùng làm khuôn hoặc dùng làm khuôn)
Cà chua	Huafan No 1	NA	Lâu chín/già cỗi	đối-effe
Cà chua	PK-TM8805R (8805R)	NA	Tính kháng dịch bệnh	cmv cp
Lúa mỳ	MON71800	MON-71800-3	Khả năng chống chịu glyphosat	cp4 epsps (aroA:CP4)
*: Cải dầu, **: Nhân giống, #: Cà tím				

Việc xử lý thực vật hoặc hạt giống được cải biến di truyền bằng hợp chất theo sáng chế có thể tạo ra tác dụng hiệp đồng hoặc hiệp đồng cộng. Ví dụ, giảm tỷ lệ bón, tăng phổ hoạt tính, tăng khả năng chống chịu với điều kiện khắc nghiệt có nguồn gốc sinh học/phi sinh học hoặc tăng cường độ ổn định bảo quản có thể cao hơn tác mong đợi từ việc bón đơn giản hợp chất theo sáng chế lên thực vật và hạt giống được cải biến di truyền.

Hợp chất theo sáng chế cũng hữu ích trong xử lý hạt giống để bảo vệ hạt giống khỏi dịch hại không xương sống. Trong phạm vi của sáng chế, xử lý hạt giống có nghĩa là cho hạt giống tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất theo sáng chế, thường được điều chế dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Phương pháp xử lý hạt giống này bảo vệ hạt giống khỏi dịch hại không xương sống có trong đất và cũng bảo vệ rễ và các bộ phận khác của thực vật tiếp xúc với đất xung quanh cây con phát triển từ hạt giống nảy mầm. Phương pháp xử lý hạt giống này cũng có thể bảo vệ tán lá bởi sự phân bố của hợp chất theo sáng chế hoặc hoạt chất thứ hai bên trong thực vật đang phát triển. Chế phẩm xử lý hạt có thể bón vào toàn bộ các loại hạt giống, bao gồm các hạt giống mà thực vật chuyển gen biểu hiện tính trạng cụ thể sẽ nảy mầm từ đó. Ví dụ cụ thể bao gồm hạt giống biểu hiện protein gây độc cho dịch hại không xương sống, như protein độc tố *Bacillus thuringiensis* hoặc hạt giống biểu hiện tính kháng chất diệt cỏ, như glyphosat axetyltransferaza, tạo ra tính kháng glyphosat. Chế phẩm xử lý hạt chứa hợp chất theo sáng chế cũng có thể làm tăng sức khỏe của thực vật sinh trưởng từ hạt giống này.

Một phương pháp xử lý hạt giống bao gồm bước phun hoặc rắc hạt giống này với hợp chất theo sáng chế (tức là dưới dạng chế phẩm được điều chế) trước khi gieo hạt. Chế phẩm để xử lý hạt chứa chất tạo màng hoặc chất kết dính. Do đó thông thường chế phẩm phủ hạt giống theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), N-oxit hoặc muối của nó, và chất tạo màng hoặc chất kết dính. Hạt giống có thể được phủ

bằng cách phun hỗn dịch đậm đặc có thể chảy trực tiếp vào lớp hạt giống được đảo trộn, sau đó sấy khô hạt giống. Theo cách khác, các loại chế phẩm khác, như chế phẩm dạng bột ẩm, dung dịch, nhũ tương hỗn dịch, chế phẩm đậm đặc có thể nhũ hóa và nhũ tương trong nước có thể được phun lên hạt giống. Phương pháp này đặc biệt hữu ích để phủ lớp màng lên hạt giống. Các phương pháp và thiết bị phủ khác nhau là đã biết trong lĩnh vực này. Các phương pháp thích hợp được mô tả trong tài liệu P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57, và các tài liệu tham khảo được liệt kê trong đó.

Hợp chất có công thức (1) và chế phẩm chứa hợp chất, riêng biệt hoặc kết hợp với chất diệt côn trùng, và chất diệt giun tròn, và chất diệt nấm khác, đặc biệt hữu ích trong xử lý hạt giống cho các cây trồng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, bắp hoặc ngô, đậu tương, bông, cây ngũ cốc (ví dụ lúa mỳ, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và lúa), khoai tây, rau xanh và cải dầu.

Chất diệt côn trùng khác có thể được kết hợp với hợp chất có công thức (1) để thu được hỗn hợp hữu ích trong xử lý hạt giống bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, chlorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprol, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gama-cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazat, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizon, methiocarb, metomyl, metopren, metoxyfenozit, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodin, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamat, triflumuron, nội độc tố delta *Bacillus thuringiensis*, toàn bộ các chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ các chủng virus nhiều hạt.

Chất diệt nấm có thể được kết hợp với hợp chất có công thức (1) để thu được hỗn hợp hữu ích trong xử lý hạt giống bao gồm amisulbrom, azoxystrobin, boscalid, carbendazim, carboxin, cymoxanil, cyproconazol, difenoconazol, dimetomorph,

fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolid, fluoxastrobin, flutriafol, fluxapyroxad, ipconazol, iprodion, metalaxyl, mefenoxam, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penflufen, picoxystrobin, prothioconazol, pyraclostrobin, sedaxan, silthiofam, tebuconazol, thiabendazol, thiophanat-metyl, thiram, trifloxystrobin và triticonazol.

Chế phẩm chứa hợp chất có công thức (1) hữu ích để xử lý hạt có thể còn chứa vi khuẩn và vi nấm có khả năng bảo vệ khỏi tác dụng gây hại của vi nấm hoặc vi khuẩn và/hoặc động vật sinh sống trong đất gây bệnh cho thực vật, như giun tròn. Vi khuẩn có hoạt 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) dưới dạng nhãn hiệu BioNemTM. Chủng *Bacillus cereus* thích hợp là chủng NCMM I-1592. Cả hai chủng *Bacillus* này được bộc lộ trong US 6,406,690. Các vi khuẩn thích hợp khác có hoạt tính diệt giun tròn là chủng *B. amyloliquefaciens* IN937a và *B. subtilis* GB03. Vi khuẩn có hoạt tính diệt vi nấm có thể bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở chủng *B. pumilus* GB34. Các loài vi nấm có hoạt tính diệt giun tròn có thể bao gồm nhưng không chỉ giới hạn ở *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* và *Purpureocillium lilacinum*.

Chế phẩm xử lý hạt có thể cũng bao gồm một hoặc nhiều hoạt chất diệt giun tròn có nguồn gốc tự nhiên, như protein kẹp tóc được phân lập từ một số vi khuẩn gây bệnh thực vật, như *Erwinia amylovora*. Ví dụ về kỹ thuật xử lý hạt giống Harpin-N-Tek là N-HibitTM Gold CST.

Chế phẩm xử lý hạt có thể cũng bao gồm một hoặc nhiều loài vi khuẩn tạo nốt sần ở rễ cây họ đậu, như vi khuẩn cố định đạm vi cộng sinh *Bradyrhizobium japonicum*. Chế phẩm ủ hạt này có thể tùy ý chứa một hoặc nhiều lipo-chitooligosacarit (LCO), là yếu tố tạo nốt sần sản sinh bởi vi khuẩn hệ rễ trong quá trình hoạt hóa hình thành nốt sần ở rễ cây họ đậu. Ví dụ, kỹ thuật xử lý hạt giống Optimize® tích hợp kỹ thuật tăng cường LCOTM kết hợp với chế phẩm ủ hạt.

Chế phẩm xử lý hạt có thể cũng bao gồm một hoặc nhiều isoflavon có thể làm tăng lượng khuẩn lạc rễ by vi nấm hệ rễ. Vi nấm hệ rễ cải thiện sinh trưởng thực vật bằng cách tăng cường khả năng hấp thu dinh dưỡng của rễ, như nước, sulfat, nitrat, phosphat và kim loại. Ví dụ về isoflavon bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, genistein,

biochanin A, formononetin, daidzein, glycitein, hesperetin, naringenin và pratensein. Formononetin là hoạt chất có trong chế phẩm ủ hạt hệ rễ, như PHC Colonize® AG.

Chế phẩm xử lý hạt có thể cũng bao gồm một hoặc nhiều chất hoạt hóa thực vật tạo ra sức đề kháng cho thực vật sau khi tiếp xúc với tác nhân gây bệnh. Ví dụ về chất hoạt hóa thực vật có cơ chế bảo vệ này là acibenzolar-*S*-metyl.

Hạt giống được xử lý chứa hợp chất theo sáng chế ở hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,1g đến 1 kg/100kg hạt giống (tức là nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% khối lượng hạt giống trước khi xử lý). Hỗn dịch có thể chảy để xử lý hạt giống chứa hoạt chất với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 70%, chất kết dính tạo màng với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 30%, chất phân tán với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,5% đến 20%, chất làm đặc với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0% đến 5%, chất màu và/hoặc chất nhuộm với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0% đến 5%, chất chống tạo bọt với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0% đến 2%, chất bảo quản với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0% đến 1%, và chất pha loãng bay hơi dạng lỏng với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0% đến 75%.

Hợp chất theo sáng chế có thể được kết hợp vào chế phẩm thuốc môi được tiêu thụ bởi dịch hại không xương sống được sử dụng trong thiết bị, như bẫy, trạm môi, và tương tự. Chế phẩm thuốc môi này có thể ở dạng chế phẩm dạng cốm chứa (a) hoạt chất, tức là lượng hữu hiệu của hợp chất có công thức (1), *N*-oxit, hoặc muối của nó; (b) một hoặc nhiều nguyên liệu thực phẩm; tùy ý (c) chất thu hút, và tùy ý (d) một hoặc nhiều chất hút ẩm. Đặc biệt là chế phẩm dạng cốm hoặc chế phẩm thuốc môi chứa hoạt chất với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,001% đến 5%, nguyên liệu thực phẩm và/hoặc chất thu hút với hàm lượng nằm trong khoảng từ 40% đến 99%; và tùy ý chất hút ẩm với hàm lượng nằm trong khoảng từ 0,05% đến 10%, hữu hiệu trong kiểm soát dịch hại không xương sống trong đất ở tỷ lệ bón rất thấp, đặc biệt ở liều lượng hoạt chất gây chế khi dịch hại ăn thay vì tiếp xúc trực tiếp. Một số nguyên liệu thực phẩm đóng vai trò là nguồn thực phẩm lẫn chất thu hút. Nguyên liệu thực phẩm bao gồm carbohydrat, protein và lipid. Ví dụ về nguyên liệu thực phẩm bao gồm bột rau, đường, tinh bột, chất béo động vật, dầu thực vật, chiết xuất nấm men và sữa đặc. Ví dụ về chất thu hút côn trùng là chất có mùi thơm và chất thơm, như chiết xuất thực vật hoặc hoa quả, hương thơm, hoặc các thành phần khác của động vật hoặc thực vật, kích dục tố hoặc các chất đã biết khác để thu hút dịch hại không xương sống đích. Ví dụ về chất hút ẩm, tức là chất duy trì độ ẩm, là glycol và các

rượu đa chức khác, glycerin và sorbitol. Đặc biệt là chế phẩm thuốc môi (và phương pháp sử dụng chế phẩm thuốc môi này) được sử dụng để kiểm soát ít nhất một dịch hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm kiến, mối và gián. Thiết bị để kiểm soát dịch hại không xương sống có thể bao gồm chế phẩm thuốc môi theo sáng chế và hộp được chế tạo để tiếp nhận chế phẩm thuốc môi này, trong đó hộp này có ít nhất một khe hở được tạo kích cỡ để cho phép dịch hại không xương sống chạy qua khe hở này sao cho dịch hại không xương sống có thể ăn chế phẩm thuốc môi từ vị trí bên ngoài hộp này, và hộp này tiếp tục được điều chỉnh để được đặt trong hoặc gần vùng sinh sống hoặc đã biết đối với dịch hại không xương sống.

Theo một phương án, sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước pha loãng chế phẩm trừ dịch hại 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 điều chế chứa hợp chất có công thức (1) và ít nhất một chất trừ dịch hại khác) với nước, và tùy ý bổ sung chất bổ trợ để thu được chế phẩm đã pha loãng, và cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của chế phẩm đã pha loãng này.

Mặc dù chế phẩm phun được điều chế nồng độ đầy đủ của chế phẩm trừ dịch hại theo sáng chế với nước có thể tạo ra hiệu lực đầy đủ để kiểm soát dịch hại không xương sống, chế phẩm bổ trợ được điều chế riêng cũng có thể được bổ sung vào hỗn hợp phun trong bình. Các chất bổ trợ bổ sung này được gọi là “chất bổ trợ phun” hoặc “chất bổ trợ trộn trong bình”, và bao gồm chất bất kỳ được trộn trong bình phun để cải thiện đặc tính của chất trừ dịch hại hoặc biến đổi đặc tính vật lý của hỗn hợp phun. Chất bổ trợ có thể chất hoạt động bề mặt, chất nhũ hóa, dầu cây trồng có nguồn gốc dầu mỏ, dầu hạt có nguồn gốc cây trồng, chất điều chỉnh độ axit, chất đệm, chất làm đặc hoặc chất khử bọt. Chất bổ trợ được sử dụng để tăng cường hiệu lực (ví dụ độ sinh khả dụng, độ bám dính, tính thấm, độ đồng nhất bao phủ và khoảng thời hạn bảo vệ), hoặc giảm thiểu hoặc loại bỏ các vấn đề phun liên quan đến độ không tương thích, tạo bọt, rửa trôi, bay hơi, làm bay hơi và phân hủy. Để thu được đặc tính tối ưu, chất bổ trợ được chọn theo đặc tính của hoạt chất, chế phẩm và đích (ví dụ cây trồng, dịch hại côn trùng).

Trong số các chất bổ trợ phun, dầu bao gồm dầu cây trồng, dầu cây trồng đậm đặc, dầu thực vật đậm đặc và dầu hạt đậm đặc được metyl hóa được sử dụng để cải thiện hiệu lực của chất trừ dịch hại, bằng cách tăng lượng phun đồng đều và đồng nhất. Khi độc tính

thực vật gây ra bởi dầu hoặc các chất lỏng không đồng tan với nước khác, chế phẩm phun điều chế từ chế phẩm theo sáng chế sẽ không chứa chất hỗ trợ dầu phun. Tuy nhiên, khi độc tính thực vật gây ra bởi chất hỗ trợ dầu phun là không đáng kể về mặt kinh tế, chế phẩm phun điều chế từ chế phẩm theo sáng chế cũng có thể chứa chất hỗ trợ dầu phun, có thể tăng cường kiểm soát dịch hại không xương sống, cũng như độ ổn định trong điều kiện trời mưa.

Sản phẩm “dầu cây trồng” chứa dầu mỏ parafin hoặc naphta với hàm lượng nằm trong khoảng từ 95% đến 98% và một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt đóng vai trò là chất nhũ hóa với hàm lượng nằm trong khoảng từ 1% đến 2%. Sản phẩm “dầu cây trồng đậm đặc” chứa dầu mỏ có thể nhũ hóa với hàm lượng nằm trong khoảng từ 80% đến 85% và chất hoạt động bề mặt dạng không ion với hàm lượng nằm trong khoảng từ 15% đến 20%. Sản phẩm “dầu thực vật đậm đặc” chứa dầu thực vật với hàm lượng nằm trong khoảng từ 80% đến 85% (tức là dầu hạt hoặc dầu quả, tốt nhất nếu có nguồn gốc từ bông, linseed, đậu tương hoặc hướng dương) và chất hoạt động bề mặt dạng không ion với hàm lượng nằm trong khoảng từ 15% đến 20%. Đặc tính hỗ trợ có thể được cải thiện bằng cách thay dầu thực vật bằng metyl este của axit béo có nguồn gốc từ dầu thực vật. Ví dụ về dầu hạt đậm đặc được metyl hóa bao gồm MSO® đậm đặc (UAP-Loveland Products, Inc.) và dầu phun được metyl hóa Premium MSO (Helena Chemical Company).

Lượng chất hỗ trợ được bổ sung vào hỗn hợp phun nhìn chung không vượt quá 2,5% thể tích, và tốt hơn nếu ở lượng nằm trong khoảng từ 0,1% đến 1% thể tích. Lượng phun của chất hỗ trợ được bổ sung vào hỗn hợp phun thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5L/ha. Ví dụ về chất hỗ trợ phun bao gồm: Adigor® (Syngenta) 47% dầu hạt cải được metyl hóa trong hydrocarbon 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 parafin.

Hợp chất theo sáng chế có thể được bón mà không cần chất hỗ trợ khác, tuy nhiên hợp chất theo sáng chế thường được bón ở dạng chế phẩm chứa một hoặc nhiều hoạt chất và chất mang, chất pha loãng, và chất hoạt động bề mặt thích hợp và có thể kết hợp với thực phẩm phụ thuộc vào mục đích sử dụng cuối cùng. Một phương pháp bón bao gồm việc phun chế phẩm phân tán trong nước hoặc dung dịch dầu tái chế chứa hợp chất theo sáng chế. Hợp chất theo sáng chế được kết hợp với dầu phun, dầu phun đậm đặc, chất

độn kết dính, chất bổ trợ, các dung môi, và chất hiệp đồng khác, như piperonyl butoxit thường tăng cường hiệu lực của hợp chất. Để sử dụng phi nông nghiệp, chế phẩm phun này có thể được phân phối từ bình phun, như bình, chai hoặc các đồ chứa khác, bằng bơm hoặc bằng cách giải phóng từ bình chứa có áp, ví dụ bình phun sương có áp. Chế phẩm phun này có thể ở các dạng khác nhau, ví dụ chế phẩm phun, chế phẩm phun sương, chế phẩm bột, chế phẩm khói hoặc chế phẩm sương mù. Do đó, chế phẩm phun này có thể còn chứa chất đẩy, chất tạo bột, v.v. Đặc biệt là chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất mang. Theo một phương án, chế phẩm phun chứa lượng hữu hiệu của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế và chất đẩy. Ví dụ về chất đẩy thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, metan, etan, propan, butan, isobutan, buten, pentan, isopentan, neopentan, penten, hydroflocarbon, cloflocarbon, dimetyl ete, và hỗn hợp của chúng. Đặc biệt là chế phẩm phun (và phương pháp sử dụng chế phẩm phun này được phân tán từ bình phun) được sử dụng để kiểm soát ít nhất một dịch hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm muỗi, ruồi đen, ruồi nhà, ruồi nai, ruồi ngựa, ong bắp cày, ong vàng, ong, ve, nhện, kiến, muỗi, và tương tự, bao gồm riêng rẽ hoặc kết hợp.

Các thử nghiệm sau kiểm chứng hiệu quả kiểm soát của hợp chất theo sáng chế trên dịch hại đặc hiệu. “Hiệu quả kiểm soát” là hiệu quả ức chế phát triển của dịch hại không xương sống (bao gồm gây chết) làm giảm đáng kể đặc tính ăn. Tuy nhiên, tác dụng bảo vệ kiểm soát dịch hại của hợp chất theo sáng chế không bị giới hạn bởi các loài này. Xem bảng chỉ số A trong phần mô tả hợp chất.

Chế phẩm và phương pháp phun trong thử nghiệm A-E

Các hợp chất thử nghiệm được điều chế bằng cách sử dụng dung dịch chứa 10% axeton, 90% nước và 300ppm chế phẩm độn dạng bột chất hoạt động bề mặt không ion X-77® chứa alkylaryl polyoxyetylen, axit béo tự do, glycol và isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Các hợp chất được điều chế được phun trong 1mL dịch lỏng thông qua vòi phun sương SUJ2 được trang bị thân tùy chỉnh 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Lúa mỳon, Illinois, USA) ở vị trí cao hơn đỉnh mỗi lô thử nghiệm 1,27 cm. Các hợp chất thử nghiệm được phun ở tỷ lệ được chỉ dẫn, và mỗi thử nghiệm được lặp lại ba lần.

Thử nghiệm A

Để đánh giá hiệu quả kiểm soát rệp đào (*Myzus persicae* (Sulzer)) thông qua cơ chế tiếp xúc và/hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, lô thử nghiệm bao gồm đồ chứa có khe hở nhỏ chứa cây củ cải 12 đến 15 ngày tuổi. Thực vật này được lây nhiễm sơ bộ bằng cách đặt lên lá của thực vật thử nghiệm 30-40 rệp trên miếng lá được cắt từ thực vật trưởng thành (phương pháp cắt lá). Rệp được chuyển lên thực vật thử nghiệm khi miếng lá bị khô. Sau khi lây nhiễm sơ bộ, đất của lô thử nghiệm được phủ bằng lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được điều chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun các hợp chất thử nghiệm được điều chế, mỗi lô thử nghiệm được để khô trong 1 giờ, sau đó nắp đáy màu đen được đặt lên trên. Các lô thử nghiệm được duy trì trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 19°C đến 21°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 50% đến 70%. Sau đó mỗi lô thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về hiệu quả gây chết côn trùng. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 80%: 1, 32, 38, 39, 40, 41, 42, 44, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 61, 63, 64, 65, 66, 68, 84, 85, 86, 87 và 88. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 80%: 2, 3, 4, 31, 32, 33, 34, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 44, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 61, 65, 66, 68, 84, 85, 86 và 87.

Thử nghiệm B

Để đánh giá hiệu quả kiểm soát rệp dưa (*Aphis gossypii* (Glover)) thông qua cơ chế tiếp xúc và/hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, lô thử nghiệm bao gồm đồ chứa có khe hở nhỏ chứa cây bông 6-7 ngày tuổi. Thực vật này được lây nhiễm sơ bộ bằng 30-40 côn trùng trên miếng lá theo phương pháp cắt lá, và đất của lô thử nghiệm được phủ bằng lớp cát.

Các hợp chất thử nghiệm được điều chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, các lô thử nghiệm được duy trì trong buồng sinh trưởng trong 6 ngày ở nhiệt độ 19°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó mỗi lô thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về hiệu quả gây chết côn trùng. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 80%: 32, 38, 42, 48, 51, 52, 53, 54, 55, 59, 64, 65, 66, 68, 84, 85, 86 và 87. Trong số các hợp

chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 80%: 2, 38, 42, 51, 52, 54, 59, 64, 65, 66, 68, 84, 85, 86 và 87.

Thử nghiệm C

Để đánh giá hiệu quả kiểm soát rầy xanh hại lá khoai tây (*Empoasca fabae*) thông qua cơ chế tiếp xúc và/hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, lô thử nghiệm bao gồm đồ chứa có khe hở nhỏ chứa cây đậu soleil 5 đến 6 ngày tuổi (đã nhú các lá sơ cấp). Cát trắng được bổ sung vào bên trên lớp đất và một lá sơ cấp được cắt trước khi phun.

Các hợp chất thử nghiệm được điều chế và phun ở nồng độ 250ppm và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, các lô thử nghiệm được để khô trong 1 giờ trước khi lây nhiễm bằng 5 rầy xanh hại lá khoai tây (rầy trưởng thành 18 đến 21 ngày tuổi). Nắp đáy màu đen được đặt lên trên mỗi lô thử nghiệm, và các lô thử nghiệm được duy trì trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở nhiệt độ 24°C và độ ẩm tương đối 70%. Sau đó mỗi lô thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về hiệu quả gây chết côn trùng. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm các hợp chất sau có hiệu quả kiểm soát rất cao (hiệu quả gây chết bằng 80% hoặc cao hơn): 56. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm các hợp chất sau có hiệu quả kiểm soát rất cao (hiệu quả gây chết bằng 80% hoặc cao hơn): 56.

Thử nghiệm D

Để đánh giá hiệu quả kiểm soát bọ trĩ hoa (*Frankliniella occidentalis*) thông qua cơ chế tiếp xúc và/hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, lô thử nghiệm bao gồm đồ chứa có khe hở nhỏ chứa cây đậu soleil 5 đến 7 ngày tuổi.

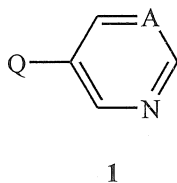
Các hợp chất thử nghiệm được điều chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, các lô thử nghiệm được để khô trong 1 giờ, sau đó 22-27 bọ trĩ hoa trưởng thành được bổ sung vào lô thử nghiệm. Nắp đáy màu đen được đặt lên trên mỗi lô thử nghiệm, và các lô thử nghiệm được duy trì trong 7 ngày ở nhiệt độ 25°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 45% đến 55%. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau có hiệu quả kiểm soát rất cao (mức độ tổn thương thực vật bằng 40% hoặc nhỏ hơn và/hoặc hiệu quả gây chết bằng 100%): 32, 35, 38 và 41. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau có hiệu quả kiểm soát rất cao (mức độ tổn thương thực vật bằng 40% hoặc nhỏ hơn và/hoặc hiệu quả gây chết bằng 100%): 2 và 31.

Thử nghiệm E

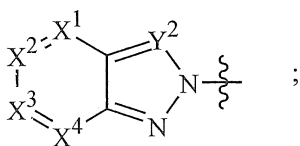
Để đánh giá hiệu quả kiểm soát bọ phấn (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) thông qua cơ chế tiếp xúc và/hoặc phân bố toàn bộ cơ thể thực vật, lô thử nghiệm bao gồm đồ chứa có khe hở nhỏ chứa cây bông 12 đến 14 ngày tuổi. Trước khi phun, cả hai lá mầm được tách ra khỏi cây bông, tách một lá thực để thử nghiệm. Các bọ phấn trưởng thành được để đẻ trứng trên cây bông, sau đó được lấy ra khỏi lô thử nghiệm. Các cây bông được lây nhiễm bằng ít nhất 15 trứng được đưa vào thử nghiệm để phun. Các hợp chất thử nghiệm được điều chế và phun ở nồng độ 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, các lô thử nghiệm được để khô trong 1 giờ. Sau đó các bình trụ được lấy ra, và các lô thử nghiệm được đưa vào buồng sinh trưởng và duy trì trong 13 ngày ở nhiệt độ 28°C và độ ẩm tương đối nằm trong khoảng từ 50% đến 70%. Sau đó mỗi lô thử nghiệm được đánh giá bằng mắt thường về hiệu quả gây chết côn trùng. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 250ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 50%: 30, 39, 40, 44, 47, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 58, 59, 60, 61, 64, 68, 84 và 85. Trong số các hợp chất có công thức (1) được thử nghiệm ở nồng độ 50ppm, các hợp chất sau có hiệu quả gây chết ít nhất bằng 50%: 30, 51 và 54.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (1), *N*-oxit hoặc muối của nó,



trong đó



Q là Q-2

A là CH;

X^1 là CR^2 , và X^2 , X^3 và X^4 đều là CH; hoặc X^2 là CR^2 , và X^1 , X^3 và X^4 đều là CH;

R^2 là $C(=Z)R^{11}$, $N(R^8)C(=NR^8)R^9$; hoặc C_2-C_6 alkoxy tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$, $C(=Z)NR^6R^7$ hoặc tối đa 3 R^y ; hoặc C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl hoặc C_2-C_4 alkynyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng $C(=Z)R^{11}$ hoặc $C(=Z)NR^6R^7$, và mỗi nhóm này tùy ý còn được thế tối đa bằng 3 R^y ;

Z là O hoặc S;

Y^2 là CR^{5a} ;

R^{5a} là H;

R^6 là H, $NR^{15}R^{16}$, OR^{17} , $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ;

R^7 là H hoặc Q^b ; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkenyl hoặc C_2-C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ; hoặc

R^6 và R^7 cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 R^x; hoặc

R⁶ và R⁷ cùng với nhau là =S(O)_pR¹⁸R¹⁹ hoặc =S(=NR²⁰)R¹⁸R¹⁹;

mỗi R^x độc lập là halogen, xyano, nitro, hydroxy, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ hoặc Q^b;

mỗi R^y độc lập là halogen, xyano, hydroxy, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², S(O)_nR²³ hoặc Q^b;

R⁸ là H, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x;

R⁹ là H, C(=NR¹⁰)R¹¹, OR²¹ hoặc NR¹⁵R¹⁶; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x; hoặc phenyl, phenoxy hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 3 dị nguyên tử 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 1 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁰ độc lập là OR¹², S(O)_nR¹³ hoặc NHR¹⁴;

mỗi R¹¹ độc lập là H; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy hoặc C₃-C₆ xycloalkoxy, mỗi nhóm này không

được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ; hoặc $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, hoặc $C(O)R^{22}$;

mỗi R^{12} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{13}$ hoặc Q^b ;

mỗi R^{13} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl;

R^{14} là C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, $C(O)R^{22}$ hoặc $C(O)OR^{21}$; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^{15} là H, $NR^{15a}R^{16a}$, OR^{17} , $C(=NR^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{21}$, $C(O)NR^{15a}R^{16a}$, $C(O)R^{22}$, $S(O)_nR^{23}$ hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ;

R^{16} là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyl hoặc C_2 - C_6 alkynyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một R^x ; hoặc

R^{15} và R^{16} cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 R^x ; hoặc

R^{15} và R^{16} cùng với nhau là $=S(O)_pR^{18}R^{19}$ hoặc $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$;

mỗi R^{15a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, $C(O)R^{27}$ hoặc $S(O)_2R^{27}$; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{16a} độc lập là H, C_1 - C_6 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc

R^{15a} và R^{16a} cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và

C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

R¹⁷ là C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁸ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R¹⁹ độc lập là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ haloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R¹⁸ và R¹⁹ cùng với nguyên tử lưu huỳnh mà chúng gắn vào tạo thành vòng;

R²⁰ là H, xyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl hoặc C(O)R²²; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²¹ độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl hoặc C₃-C₆ haloxycloalkyl; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R²² độc lập là C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₃-C₆ haloxycloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkoxy, C₃-C₆ xycloalkoxy hoặc NR²⁵R²⁶; hoặc phenyl, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R^{23} độc lập là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_6 haloxycloalkyl, C_3 - C_6 xycloalkylalkyl hoặc C_3 - C_6 haloxycloalkylalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{24} độc lập là C_1 - C_4 alkyl;

mỗi R^{25} độc lập là H, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{26} độc lập là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl; hoặc phenyl, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy; hoặc

R^{25} và R^{26} độc lập cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 7 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ $C(=O)$ và $C(=S)$ và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, $S(O)$ hoặc $S(O)_2$, vòng 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{27} độc lập là C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy hoặc $NR^{29}R^{30}$; hoặc phenyl hoặc dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh, 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_3 - C_6 xycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

mỗi R^{28} độc lập là C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl hoặc phenyl;

mỗi R^{29} độc lập là H hoặc Q^b ; hoặc C_1 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi R³⁰ độc lập là H hoặc Q^b; hoặc C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₂-C₆ alkenyl hoặc C₂-C₆ 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy; hoặc

R²⁹ và R³⁰ cùng với nguyên tử nitơ gắn kết với chúng tạo thành vòng có 3 đến 10 cạnh chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, vòng này không được thế hoặc được thế tối đa bằng 4 phần tử thế độc lập được chọn từ nhóm bao gồm halogen, xyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi Q^b độc lập là phenyl, dị vòng thơm có 5 hoặc 6 cạnh hoặc dị vòng không thơm có 3 đến 6 cạnh, mỗi vòng này chứa các đỉnh trên vòng được chọn từ các nguyên tử cacbon và tối đa 2 dị nguyên tử 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 đỉnh nguyên tử cacbon trên vòng độc lập được chọn từ C(=O) và C(=S) và đỉnh nguyên tử lưu huỳnh trên vòng được chọn từ S, S(O) hoặc S(O)₂, mỗi vòng 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, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy;

mỗi n độc lập bằng 0, 1 hoặc 2; và

p bằng 1 hoặc 2;

với điều kiện là hợp chất này không phải là este metyl của axit 2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-carboxylic.

2. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất này được chọn từ nhóm bao gồm: 3-(methylthio)-1-[2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-4-yl]-1-propanon; 3-(metoxymethylamino)-1-[2-(3-pyridinyl)-2H-indazol-5-yl]-1-propanon; α-oxo-2-(3-pyridinyl)-N-(2,2,2-trifloetyl)-2H-indazol-5-axetamit; 5-(2-metylpropoxy)-2-(3-pyridinyl)-2H-indazol; α-metyl-2-(3-

pyridinyl)-*N*-(2-pyrimidinylmetyl)-2*H*-indazol-5-axetamit; 2-(3-pyridinyl)-*N*-(2-pyrimidinylmetyl)-2*H*-indazol-5-axetamit; và *N*-(1-xyano-1-metyletyl)- α -metyl-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-5-axetamit.

3. Chế phẩm trừ dịch hại chứa hợp chất theo điểm 1 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, trong đó chế phẩm này tùy ý còn chứa ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung.

4. Chế phẩm theo điểm 3, trong đó ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acephat, acequinocyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazat, bistrifluron, borat, buprofezin, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozit, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprol, cyclaniliprol, xycloprothrin, xycloxaprid, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gama-cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazin, deltamethrin, diafenthiuron, điazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimetoat, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxit, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flucythrinat, flufenerim, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, fluorpyram, flupiprol, flupyradifuron, fluvalinat, tau-fluvalinat, fonophos, formetanat, fosthiazat, halofenozit, heptafluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, xà phòng diệt côn trùng, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizon, metaldehyt, methamidophos, methidathion, methiodicarb, metomyl, metopren, metoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, monofluthrin, metoxyfenozit, nitenpyram, nithiazin, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargit, protrifenbute, pyflubumid, pymetrozin, pyrafluprol, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, pyriprol, pyriproxifen, rotenon, ryanodin, silafluofen, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflo, tebufenozit, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos,

tetramethrin, tetramethylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamat, trichlorfon, triflumuron, toàn bộ các chủng *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn ký sinh và gây bệnh, toàn bộ các chủng virus nhiều hạt, virus ký sinh và gây bệnh và vi nấm ký sinh và gây bệnh.

5. Chế phẩm theo điểm 4, trong đó ít nhất một hoạt chất hoặc hợp chất có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, 3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-N-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylamino)carbonyl]phenyl]-1H-pyrazol-5-carboxamit, buprofezin, carbaryl, cartap, chlorantraniliprol, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprol, cyclaniliprol, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, gama-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprol, flupyradifuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazat, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizon, methiodicarb, metomyl, metopren, metoxyfenozit, metofluthrin, monofluthrin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pyflubumid, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodin, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, tetramethylfluthrin, triazamat, triflumuron, toàn bộ các chủng *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ các chủng virus nhiều hạt.

6. Phương pháp kiểm soát dịch hại không xương sống, bao gồm bước cho dịch hại không xương sống này hoặc môi trường sinh sống của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu của hợp chất theo điểm 1.

7. Hạt giống được xử lý, chứa hợp chất theo điểm 1 ở lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% khối lượng hạt giống trước khi xử lý.