



(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)



1-0041772

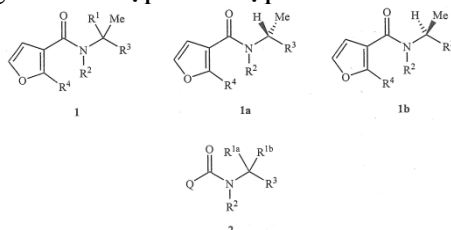
(51)⁸ C07D 333/38; A01N 43/10; C07D
277/56; C07D 307/08; A01N 43/06;
A01N 43/28

(13) B

- (21) 1-2018-02776 (22) 08/12/2016
(86) PCT/US2016/065580 08/12/2016 (87) WO2017/116646 06/07/2017
(30) 62/272,728 30/12/2015 US; 62/353,795 23/06/2016 US
(45) 25/11/2024 440 (43) 26/11/2018 368A
(73) E I DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
Chestnut Run Plaza 974 Centre Road, P.O. Box 2915 Wilmington, Delaware 19805,
United States of America
(72) LAHM, George Philip (US); DEANGELIS, Andrew Jon (US); CAMPBELL,
Matthew James (US).
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

(54) HỢP CHẤT AMIT DI VÒNG CÓ TÁC DỤNG DIỆT GIUN TRÒN, CHẾ PHẨM
CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP ĐỂ PHÒNG TRỪ GIUN TRÒN
TRÚ NGỤ TRONG ĐẤT

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất có Công thức 1, 1a, 1b và 2,



trong đó:

R^1 , R^{1a} , R^{1b} , R^2 , R^3 và R^4 là như được xác định trong Bản mô tả.

Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm chứa hợp chất có Công thức 1, 1a và 1b, và phương pháp để phòng trừ giun tròn ký sinh, phương pháp này bao gồm việc cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất hoặc chế phẩm của nó có Công thức 1, 1a, 1b và 2.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

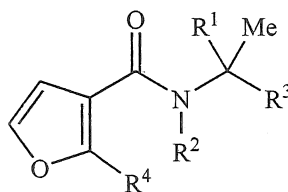
Sáng chế đề cập đến hợp chất amit dị vòng nhất định và chế phẩm của nó thích hợp để sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp, và phương pháp sử dụng nó để phòng trừ giun tròn ký sinh ở cả môi trường nông nghiệp và môi trường phi nông nghiệp.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Việc phòng trừ giun tròn ký sinh trên thực vật là điều vô cùng quan trọng để đạt được hiệu quả thu hoạch cao. Sự hư hỏng rễ do giun tròn gây ra có thể làm giảm một cách đáng kể hiệu quả và chất lượng mùa màng và nhờ đó dẫn đến giá thành gia tăng đến người sử dụng. Do sự phát triển lan rộng của sự kháng lại các tác nhân diệt giun sán ở ký sinh giun tròn, giun tròn vẫn tiếp tục gây ra các vấn đề ở vật nuôi bất chấp các tác nhân trị liệu hóa học hiện có. Do đó, vẫn tiếp tục cần các hợp chất mới mà có hiệu quả hơn, giá thành thấp hơn, độc tố thấp hơn, an toàn hơn cho môi trường hoặc có cách thức tác dụng khác nhau.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề cập đến hợp chất có Công thức 1 (bao gồm tất cả các chất đồng phân lập thể) và chế phẩm chứa chúng và việc sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



1

trong đó

R^1 là H hoặc methyl;

R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl hoặc Br;

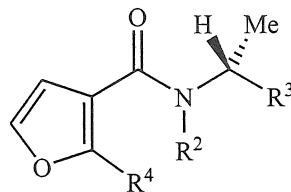
mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl;

với điều kiện là (i) khi R^1 và R^2 là H, thì R^3 không phải là C_2-C_3 alkenyl, C_2-C_3 alkynyl, xyclopropyl, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, C_2-C_3 alkyl không được thế, hoặc C_2-C_3 alkyl được thế bằng Cl hoặc Br; (ii) khi R^1 là methyl, thì R^3 không phải là etyl; và (iii) khi R^1 là H và R^2 là methyl, thì R^3 không phải là etyl.

Sáng chế còn đề cập đến hợp chất có Công thức 1a và chế phẩm chứa chúng và việc sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



1a

trong đó:

R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

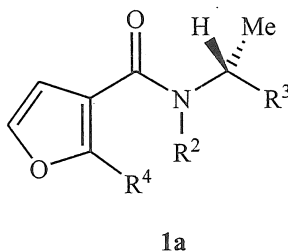
R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl.

Sáng chế còn đề cập đến hợp chất có Công thức 1a và chế phẩm chứa chúng và việc sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



trong đó:

R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

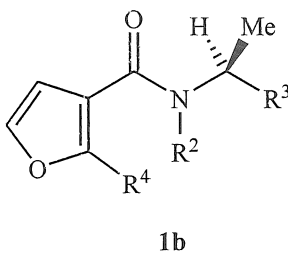
mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1 – C_3 alkoxy, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_1 – C_3 alkylthio, C_1 – C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1 – C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1 – C_3 alkoxy, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_1 – C_3 alkylthio, C_1 – C_3 alkylsulfinyl, C_1 – C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1 – C_6 alkyl;

với điều kiện là (i) khi R^2 là H, thì R^3 không phải là C_2 – C_3 alkenyl, C_2 – C_3 alkynyl, xyclopropyl, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, không được thế C_2 – C_3 alkyl, hoặc C_2 – C_3 alkyl được thế bằng Cl hoặc Br; và (ii) khi R^2 là metyl, thì R^3 không phải là etyl.

Sáng chế còn đề cập đến hợp chất có Công thức 1b và chế phẩm chứa chúng và việc sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



trong đó:

R^2 là H; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_2 – C_6 alkylcarbonyl, C_2 – C_6 alkoxy carbonyl, C_1 – C_6 alkylthio hoặc C_1 – C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2 – C_{16} alkyl, C_2 – C_{16} alkenyl, C_2 – C_{16} alkynyl hoặc C_3 – C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

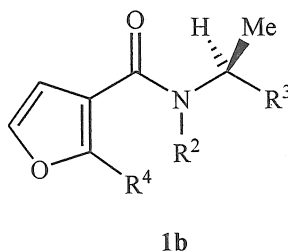
R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1 – C_3 alkoxy, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_1 – C_3 alkylthio, C_1 – C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1 – C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl.

Sáng chế còn đề cập đến hợp chất có Công thức 1b và chế phẩm chứa chúng và việc sử dụng chúng để phòng trừ giun tròn ký sinh:



trong đó:

R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl;

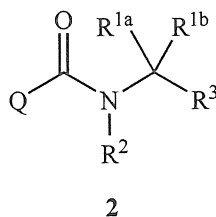
với điều kiện là (i) khi R^2 là H, thì R^3 không phải là C_2-C_3 alkenyl, C_2-C_3 alkynyl, xyclopropyl, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2SCH_3$, không được thế C_2-C_3 alkyl, hoặc C_2-C_3 alkyl được thế bằng Cl hoặc Br; và (ii) khi R^2 là metyl, thì R^3 không phải là etyl.

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng. Theo một phương án, sáng chế còn đề xuất chế phẩm để phòng trừ giun tròn ký sinh chứa hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế đề xuất phương pháp để phòng trừ giun tròn ký sinh, phương pháp này bao gồm việc cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong sáng chế này). Sáng chế còn đề cập đến phương pháp mà, trong đó: giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt sinh học hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế còn đề xuất phương pháp để bảo vệ hạt tránh khỏi giun tròn ký sinh, phương pháp này bao gồm việc cho hạt tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong sáng chế này). Sáng chế còn đề cập đến hạt đã được xử lý.

Sáng chế còn đề xuất phương pháp để phòng trừ giun tròn ký sinh, phương pháp này bao gồm việc cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất có Công thức 2



trong đó:

Q là vòng furan, thiophen hoặc thiazol được thế bằng R^4 ở nguyên tử cacbon liên
kề với nguyên tử cacbon mà qua đó vòng furan, thiophen hoặc thiazol được
liên kết với phần còn lại của Công thức 2;

R^{1a} là C_1 – C_6 alkyl hoặc C_3 – C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc
được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^{1b} là H hoặc C_1 – C_3 alkyl; hoặc

R^{1a} và R^{1b} cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành
vòng xycloalkyl có từ 3 đến 6 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng ít
nhất một nhóm R^5 ;

R^2 là H; hoặc C_1 – C_6 alkyl, C_2 – C_6 alkenyl, C_2 – C_6 alkynyl, C_3 – C_6 xycloalkyl,
 C_2 – C_6 alkylcarbonyl, C_2 – C_6 alkoxy carbonyl, C_1 – C_6 alkylthio hoặc C_1 – C_6
alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất
một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2 – C_{16} alkyl, C_2 – C_{16} alkenyl, C_2 – C_{16} alkynyl hoặc C_3 – C_6 xycloalkyl, mỗi
nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano; với điều kiện là khi R^4 là Me, thì R^3 không
phải là C_2 alkyl không được thế ;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1 – C_3 alkoxy, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_1 – C_3
alkylthio, C_1 – C_3 alkylsulfinyl, hoặc C_1 – C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1 – C_3 alkoxy, C_3 – C_6 xycloalkyl, C_1 – C_3
alkylthio, C_1 – C_3 alkylsulfinyl, C_1 – C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1 – C_6 alkyl.

Sáng chế còn đề cập đến phương pháp mà, trong đó: giun tròn ký sinh hoặc môi
trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt
sinh học hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ
nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế

phẩm này còn tùy ý chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế còn đề xuất phương pháp để bảo vệ hạt tránh khỏi giun tròn ký sinh, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc hạt với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất có Công thức 2 (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong sáng chế này). Sáng chế còn đề cập đến hạt đã được xử lý.

Mô tả chi tiết sáng chế

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

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

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

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

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

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

Như được sử dụng trong sáng chế và yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ "giun tròn" dùng để chỉ sinh vật sống ngành Giun tròn. Như được xác định thông thường, "loài ký sinh" sống hoặc sinh trưởng bên trong hoặc ăn sinh vật sống khác (như thực vật, động vật, hoặc người) được mô tả như là "vật chủ". Trong sáng chế và yêu cầu bảo hộ này, "giun tròn ký sinh" cụ thể dùng để chỉ giun tròn gây tổn thương hoặc phá hủy mô hoặc gây ra các dạng bệnh khác ở thực vật, động vật (cụ thể là động vật có xương sống) hoặc người.

"Sự lan tràn phá hoại" của loài ký sinh dùng để chỉ sự có mặt của loài ký sinh với số lượng rất lớn gây ra rủi ro cho thực vật, người hoặc động vật. Sự có mặt này có thể là trong môi trường, ví dụ, trong nhà của người hoặc trong chuồng của động vật, hoặc tài sản hoặc cấu trúc xung quanh, trong vụ mùa nông nghiệp hoặc dạng thực vật khác, trong ổ của động vật, trên da hoặc lông của động vật, v. v... Khi sự lan tràn phá hoại này để chỉ sự lan tràn bên trong động vật, ví dụ, trong máu hoặc các mô bên trong khác, thuật ngữ "sự lan tràn phá hoại" cũng dự định đồng nghĩa với thuật ngữ, "gây nhiễm" như được hiểu thông thường trong lĩnh vực kỹ thuật này, trừ khi có quy định khác.

Như được đề cập trong bản mô tả và phần yêu cầu bảo hộ, thuật ngữ "diệt ký sinh trùng" và "có tác dụng diệt ký sinh trùng" dùng để chỉ tác dụng đáng kể đối với giun tròn ký sinh để tạo ra bảo vệ của thực vật, động vật hoặc người khỏi loài gây hại này. Tác dụng diệt ký sinh trùng thường đề cập đến việc làm giảm sự xuất hiện hoặc hoạt tính của giun tròn ký sinh. Tác dụng đối với giun tròn bao gồm chết hoại, chết,

làm chậm sự phát triển, làm giảm sự di động hoặc làm giảm khả năng tồn tại trên hoặc trong vật chủ thực vật, động vật hoặc người, làm giảm ăn và ức chế sinh sản. Các tác dụng này đối với giun tròn ký sinh tạo ra tác dụng phòng trừ (bao gồm ngăn ngừa, làm giảm hoặc hạn chế) sự quấy phá hoặc nhiễm ký sinh của thực vật, động vật hoặc người. Vì vậy “phòng trừ” giun tròn ký sinh nghĩa là đạt được hiệu quả diệt loài ký sinh đối với giun tròn. Các cụm từ “lượng hữu hiệu có tác dụng diệt loài ký sinh” và “lượng hữu hiệu sinh học” trong trường hợp ứng dụng hợp chất hóa học để phòng trừ giun tròn ký sinh dùng để chỉ lượng hợp chất đủ để phòng trừ giun tròn ký sinh.

Thuật ngữ "nông nghiệp" dùng để chỉ việc sản xuất cây trồng trên cánh đồng dùng làm lương thực và sợi và bao gồm sự sinh trưởng của đậu tương và các cây họ đậu khác, ngũ cốc (ví dụ, lúa mỳ, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, gạo, ngô), các loại rau lấy lá (ví dụ, rau diếp, cải bắp, và các cây trồng bao cánh khác), các loại rau lấy quả (ví dụ, cà chua, hồ tiêu, cà, cải bắp và bầu bí), khoai tây, khoai tây ngọt, nho, bông, các cây ăn quả (ví dụ, táo, quả hột cứng và cam quýt), quả nhỏ (trứng cá, anh đào) và cây trồng đặc sản khác (ví dụ, cây cải dầu, cây hướng dương, oliu).

Thuật ngữ "phi nông nghiệp" dùng để chỉ các cây trồng trong vườn khác (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây dùng để trang trí không trồng ngoài đồng), các công trình thương mại và nhà ở thành phố và các khu công nghiệp, lớp đất mặt (trong lĩnh vực thương mại, sân gôn, nhà ở, khu vui chơi giải trí, v...v.), các sản phẩm gỗ, sản phẩm bảo quản trong nông lâm nghiệp và các ứng dụng trong lĩnh vực y tế (người) và thú y (vật nuôi cảnh, gia súc, gia cầm, các động vật không thuần hoá như động vật hoang dại).

Các ứng dụng phi nông nghiệp bao gồm bảo vệ động vật khỏi loài ký sinh không xương sống việc cho động vật cần được bảo vệ dùng lượng có tác dụng diệt ký sinh trùng hữu hiệu (tức là hữu hiệu sinh học) của hợp chất theo sáng chế, thường trong ở dạng chế phẩm được chế hoá để dùng cho thú y.

Trong các phần trích dẫn ở trên, thuật ngữ “alkyl”, được sử dụng riêng hoặc trong các từ kết hợp như “alkylthio” hoặc “haloalkyl” bao gồm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metyl, etyl, *n*-propyl, *i*-propyl, hoặc các chất đồng phân butyl, pentyl hoặc hexyl khác nhau. “Alkenyl” bao gồm alken mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, và các chất đồng phân khác nhau butenyl, pentenyl và

hexenyl. “Alkenyl” cũng bao gồm polyen như 1,2-propadienyl và 2,4-hexadienyl. “Alkynyl” bao gồm alkyn mạch thẳng hoặc mạch nhánh như etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl và các chất đồng phân butynyl, pentynyl và hexynyl khác nhau. “Alkynyl” còn có thể bao gồm các nhóm chứa nhiều liên kết ba như 2,5-hexadiynyl.

“Alkoxy” bao gồm, ví dụ, metoxy, etoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy và các chất đồng phân butoxy, pentoxy và hexyloxy khác nhau.

“Xycloalkyl” bao gồm, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl và xyclohexyl. Thuật ngữ “xycloalkylalkyl” để chỉ việc thế xycloalkyl trên nhóm alkyl. Ví dụ về “xycloalkylalkyl” bao gồm xyclopropylmetyl, xyclopentyletyl, và các nhóm xycloalkyl khác liên kết với các nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh.

Thuật ngữ “halogen”, khi được sử dụng riêng biệt hoặc trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm flo, clo, brom hoặc iot. Ngoài ra, khi được sử dụng trong các từ kết hợp như “haloalkyl”, hoặc khi được sử dụng trong phần mô tả như “alkyl được thế bằng halogen” thì alkyl này có thể được thế một phần hoặc hoàn toàn bằng nguyên tử halogen có thể là giống nhau hoặc khác nhau. Ví dụ về “haloalkyl” hoặc “alkyl được thế bằng halogen” bao gồm F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 và CF_3CCl_2 .

Thuật ngữ “alkylthio” bao gồm các nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh như metylthio, etylthio, và các chất đồng phân propylthio, butylthio, pentylthio và hexylthio khác nhau. “Alkylsulfinyl” bao gồm cả hai chất đồng phân đối ảnh của nhóm alkylsulfinyl. Ví dụ về “alkylsulfinyl” bao gồm $\text{CH}_3\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)-}$ và các chất đồng phân butylsulfinyl, pentylsulfinyl và hexylsulfinyl khác nhau. Ví dụ về “alkylsulfonyl” bao gồm $\text{CH}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2-$, và chất đồng phân butylsulfonyl, pentylsulfonyl và hexylsulfonyl khác nhau. Các chữ viết tắt hóa học S(O) và S(=O) được sử dụng ở đây là nhóm sulfinyl. Các chữ viết tắt hóa học SO_2 , S(O)_2 và S(=O)_2 được sử dụng ở đây là nhóm sulfonyl.

“Alkylcarbonyl” để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh liên kết với nhóm C(O) . Các chữ viết tắt hóa học C(O) và C(=O) được sử dụng ở đây là nhóm

carbonyl. Ví dụ về “alkylcarbonyl” bao gồm $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_2CH_3$ và $C(O)CH(CH_3)_2$.

“Alkoxycarbonyl” để chỉ nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh liên kết với nhóm CO_2 . Các chữ viết tắt hóa học CO_2 , $C(O)O$ và $C(=O)O$ được sử dụng ở đây là nhóm oxycarbonyl. Ví dụ về “alkoxycarbonyl” bao gồm $C(O)OCH_3$, $C(O)OCH_2CH_3$, $C(O)OCH_2CH_2CH_3$ và $C(O)OCH(CH_3)_2$.

Tổng số nguyên tử cacbon trong phân tử thể được biểu thị bằng tiền tố “Ci-Cj”. Ví dụ, C_1-C_6 alkyl là để chỉ metyl, etyl, và các chất đồng phân propyl, butyl, pentyl và hexyl khác nhau.

Như được sử dụng trong bản mô tả này, sẽ áp dụng các định nghĩa sau trừ khi có quy định khác. Thuật ngữ “tùy ý được thể” được sử dụng hoán đổi với cụm từ “được thể hoặc không được thể” hoặc với thuật ngữ “(không) được thể”. Cụm từ “tùy ý được thể bằng từ 1 đến 4 phần tử thể” có nghĩa là không có phần tử thể (tức là không được thể) hoặc có 1, 2, 3 hoặc 4 phần tử thể (giới hạn bởi số vị trí liên kết có thể). Trừ khi có quy định khác, nhóm được thể tùy ý có thể có phần tử thể ở mỗi vị trí có thể thể của nhóm này, và mỗi việc thể là độc lập với nhau.

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

Hợp chất được chọn từ Công thức 1, 1a hoặc 1b thường tồn tại ở hơn một dạng, và do đó Công thức 1, 1a hoặc 1b bao gồm tất cả các dạng kết tinh và không kết tinh của hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b. Dạng không kết tinh bao gồm các phương án là chất rắn như sáp và gồm cũng như các phương án là chất lỏng như dung dịch và chất nóng chảy. Dạng kết tinh bao gồm các phương án về cơ bản là dạng tinh thể đơn và các phương án là hỗn hợp đa hình (tức là các dạng kết tinh khác nhau). Thuật ngữ “đa hình” dùng để chỉ dạng kết tinh cụ thể của hợp chất hoá học có thể kết tinh ở các dạng kết tinh khác nhau, các dạng này có bố trí và/hoặc cấu hình riêng khác nhau của phân

tử trong mạng tinh thể. Mặc dù chất đa hình có thể có thành phần hoá học tương tự, chúng cũng có thể có thành phần khác do sự có mặt hoặc không có mặt của nước hoặc phân tử khác đồng kết tinh, có thể liên kết yếu hoặc mạnh trong mạng tinh thể. Chất đa hình có thể khác về đặc điểm hoá học, lý học và sinh học như hình dạng tinh thể, tỷ trọng, độ cứng, màu sắc, độ bền hoá học, điểm chảy, độ hút ẩm, khả năng tạo huyền phù, tốc độ hoà tan và độ sinh khả dụng. Chuyên gia trong lĩnh vực này sẽ đánh giá đúng dạng đa hình của hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b có thể bộc lộ tác dụng có lợi (ví dụ, thích hợp để điều chế chế phẩm hữu ích) hơn dạng đa hình khác hoặc hỗn hợp chứa chất đa hình của cùng hợp chất có công thức 1. Việc điều chế và tách dạng đa hình cụ thể của hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b có thể đạt được bằng phương pháp mà chuyên gia trong lĩnh vực này đã biết kể cả, ví dụ, việc kết tinh bằng cách sử dụng dung môi và nhiệt độ được lựa chọn.

Các phương án của sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế bao gồm các phương án được mô tả dưới đây. Trong các phương án sau, hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b định nghĩa của phân tử thể được nêu trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế trừ khi có quy định khác trong phần Các phương án thực hiện sáng chế.

Phương án 1. Hợp chất có Công thức 1a.

Phương án 2. Hợp chất có Công thức 1b.

Phương án 3. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^2 là H.

Phương án 4. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là C_2-C_6 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thể hoặc được thể bằng ít nhất một nhóm R^6 .

Phương án 4a. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là C_2-C_6 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl.

Phương án 4b. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là C_3-C_6 alkyl hoặc xyclopropyl.

Phương án 4c. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl.

Phương án 4d. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là t-butyl hoặc xyclopropyl.

Phương án 4e. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là isopropyl.

Phương án 4f. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là s-butyl.

Phương án 4g. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là t-butyl.

Phương án 4h. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$.

Phương án 4i. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^3 là xyclopropyl.

Phương án 5. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^3 là isopropyl.

Phương án 5a. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^3 là s-butyl.

Phương án 5b. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^3 là t-butyl.

Phương án 5c. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$.

Phương án 5d. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^3 là Xyclopropyl.

Phương án 6. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^3 là isopropyl.

Phương án 6a. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^3 là s-butyl.

Phương án 6b. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^3 là t-butyl.

Phương án 6c. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$.

Phương án 6d. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^3 là Xyclopropyl.

Phương án 7. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^3 là isopropyl.

Phương án 7a. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^3 là s-butyl.

Phương án 7b. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^3 là t-butyl.

Phương án 7c. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$.

Phương án 7d. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^3 là Xyclopropyl.

Phương án 8. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án 8a. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^4 là Cl.

Phương án 8b. Hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, trong đó: R^4 là Br.

Phương án 9. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án 9a. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^4 là Cl.

Phương án 9b. Hợp chất có Công thức 1, trong đó: R^4 là Br.

Phương án 10. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án 10a. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^4 là Cl.

Phương án 10b. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó: R^4 là Br.

Phương án 11. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án 11a. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^4 là Cl.

Phương án 11b. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó: R^4 là Br.

Các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–11b trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, có thể được kết hợp theo cách bất kỳ, và phần mô tả về các cải biến trong các phương án không những đề cập đến hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b mà còn đề cập đến hợp chất ban đầu và hợp chất trung gian có thể sử dụng để điều chế hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b. Ngoài ra, các phương án theo sáng chế, bao gồm các phương án 1–11b trên đây cũng như các phương án khác bất kỳ được mô tả trong bản mô tả này, và tổ hợp bất kỳ của chúng, đề cập đến chế phẩm và phương pháp theo sáng chế.

Tổ hợp của các phương án 1–11b được minh họa bởi:

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

R^2 là H;

R^3 là C_2 – C_6 alkyl hoặc C_3 – C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl.

Phương án B. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là C_2-C_6 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án C. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là C_3-C_6 alkyl hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án D. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án E. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án E1. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án E2. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án F1. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án F2. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là s-butyl; và

R^4 là Cl.

Phương án F3. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl; và

R^4 là Cl.

Phương án F4. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$; và

R^4 là Cl.

Phương án F5. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là Xyclopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án G1. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án G2. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là s-butyl; và

R^4 là Br.

Phương án G3. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl; và

R^4 là Br.

Phương án G4. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$; và

R^4 là Br.

Phương án G5. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là Xyclopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án H. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $\text{C}_2\text{--C}_6$ alkyl hoặc $\text{C}_3\text{--C}_6$ xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl.

Phương án I. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là C_2-C_6 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án J. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là C_3-C_6 alkyl hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án K. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án L. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl hoặc Br.

Phương án M1. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án M2. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl, s-butyl, t-butyl, $CH_2C(CH_3)_3$ hoặc xyclopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án N1. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án N2. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là s-butyl; và

R^4 là Cl.

Phương án N3. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl; và

R^4 là Cl.

Phương án N4. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $CH_2C(CH_3)_3$; và

R^4 là Cl.

Phương án N5. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là Xyclopropyl; và

R^4 là Cl.

Phương án O1. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là isopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án O2. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là s-butyl; và

R^4 là Br.

Phương án O3. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là t-butyl; và

R^4 là Br.

Phương án O4. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$; và

R^4 là Br.

Phương án O5. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là Xyclopropyl; và

R^4 là Br.

Phương án P1. Hợp chất có Công thức 1, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-\text{CR}^{6a}\text{R}^{6b}\text{R}^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

Phương án P2. Hợp chất có Công thức 1a, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

Phương án P3. Hợp chất có Công thức 1b, trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

Phương án Q1. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 55:45; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q2. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 65:35; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl; C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q3. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 75:25; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q4. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 85:15; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q5. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 95:5; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q6. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 97:3; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q7. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 99:1; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án Q8. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a và hợp chất có Công thức 1b, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a is essentially 100:0; và

trong đó R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxy carbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano;

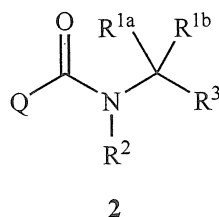
mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl; và

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

Phương án R1. Phương pháp để phòng trừ giun tròn trú ngụ trong đất, phương pháp này bao gồm việc cho giun tròn hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất được chọn từ Công thức 2,



trong đó:

Q là vòng furan, thiophen hoặc thiazol được thế bằng R^4 ở nguyên tử cacbon liên kề với nguyên tử cacbon mà qua đó vòng furan, thiophen hoặc thiazol được liên kết với phần còn lại của Công thức 2;

R^{1a} là C_1-C_6 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^{1b} là H hoặc C_1-C_3 alkyl; hoặc

R^{1a} và R^{1b} cùng nhau cùng với nguyên tử cacbon mà chúng gắn vào tạo thành vòng xycloalkyl có từ 3 đến 6 cạnh, không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^2 là H; hoặc C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_1-C_6 alkylthio hoặc C_1-C_6 alkylsulfonyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^5 ;

R^3 là C_2-C_{16} alkyl, C_2-C_{16} alkenyl, C_2-C_{16} alkynyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl, mỗi nhóm này không được thế hoặc được thế bằng ít nhất một nhóm R^6 ;

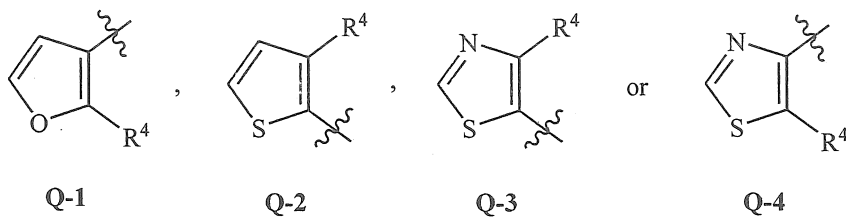
R^4 là Cl, Br, I, CH_3 , CF_3 hoặc xyano; với điều kiện là khi R^4 là Me, thì R^3 không phải là không được thế C_2 alkyl;

mỗi nhóm R^5 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, hoặc C_1-C_3 alkylsulfonyl;

mỗi nhóm R^6 độc lập là halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_3-C_6 xycloalkyl, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $SiR^aR^bR^c$; và

mỗi nhóm R^a , R^b và R^c độc lập là C_1-C_6 alkyl.

Phương án R2. Phương pháp theo Phương án R1, trong đó Q được chọn từ nhóm bao gồm:



Phương án R3. Phương pháp theo Phương án R1, trong đó Q là Q-1.

Các phương án đặc biệt bao gồm hợp chất có Công thức 1 và 1b được chọn từ nhóm bao gồm (Số hợp chất là trong Bảng danh mục A-C2):

hợp chất 9;

hợp chất 11;

hợp chất 26;

hợp chất 40;

hợp chất 43;

hợp chất 78;

hợp chất 80; và

hợp chất 84.

Các phương án đặc biệt further bao gồm hợp chất có Công thức 1b được chọn từ nhóm bao gồm (Số hợp chất là trong Bảng danh mục A-C2):

hợp chất 9;

hợp chất 11;

hợp chất 26;

hợp chất 40;

hợp chất 43;

hợp chất 78;

hợp chất 80; và

hợp chất 84.

Đáng lưu ý là hợp chất theo sáng chế được đặc trưng bởi sự chuyển hoá thuận lợi và/hoặc kiểu tồn dư đất và có hoạt tính phòng trừ phổ giun tròn ký sinh trong nông nghiệp và phi nông nghiệp.

Đặc biệt lưu ý là các phương án của sáng chế vì lý do phổ phòng trừ giun tròn ký sinh và ý nghĩa kinh tế, bảo vệ cây nông nghiệp khỏi thương tổn do giun tròn ký sinh gây ra bằng cách phòng trừ giun tròn ký sinh là. Hợp chất theo sáng chế được quan tâm vì đặc điểm hoán chuyển thuận lợi của chúng hoặc nội hấp trong cây cũng bảo vệ lá hoặc các phần khác của cây không trực tiếp được tiếp xúc với hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

Các phương án thực hiện cũng được ưu tiên theo sáng chế là các chế phẩm chứa hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây, cũng như các phương án thực hiện bất kỳ khác theo sáng chế, và hỗn hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn bao gồm ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung.

Các phương án thực hiện cũng được ưu tiên theo sáng chế là các chế phẩm để phòng trừ giun tròn ký sinh chứa lượng hữu hiệu sinh học hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây, cũng như các phương án thực hiện bất kỳ khác theo sáng chế, và hỗn hợp bất kỳ của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này tùy ý còn chứa lượng hữu hiệu sinh học của ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung. Các phương án thực hiện theo sáng chế còn gồm các phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh bao gồm bước cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây (ví dụ, chế phẩm theo sáng chế).

Các phương án thực hiện theo sáng chế cũng gồm chế phẩm chứa hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Các phương án thực hiện theo sáng chế còn gồm các phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh bao gồm bước cho đất tiếp xúc với chế phẩm lỏng ở dạng ngấm vào đất chứa lượng hữu hiệu sinh học hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây.

Các phương án thực hiện theo sáng chế cũng gồm chế phẩm phun để phòng trừ giun tròn ký sinh chứa lượng hữu hiệu sinh học hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây và chất đẩy. Các phương án thực hiện theo sáng chế còn gồm chế phẩm môi để phòng trừ giun tròn ký sinh chứa lượng hữu hiệu sinh học hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây, một hoặc nhiều nguyên liệu thức ăn, tùy ý chất hấp dẫn, và tùy ý chất giữ ẩm.

Các phương án theo sáng chế cũng bao gồm phương pháp bảo vệ hạt khỏi giun tròn ký sinh bao gồm bước cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất của các phương án thực hiện bất kỳ trên đây.

Phương án của sáng chế cũng bao gồm phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh bao gồm bước cho giun tròn ký sinh hoặc môi trường xung quanh chúng tiếp xúc với hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b hoặc Công thức 2 (ví dụ, dưới dạng chế phẩm được mô tả trong bản mô tả này) với lượng hữu hiệu về mặt sinh học, với điều kiện phương pháp này không phải là phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật.

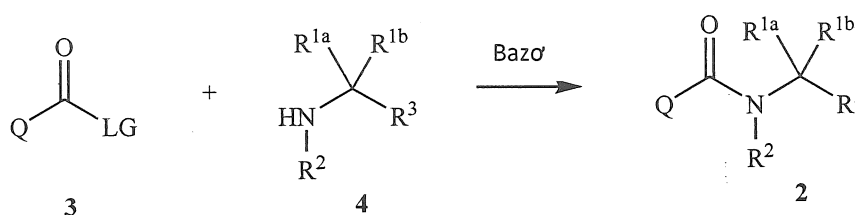
Sáng chế còn đề cập đến phương pháp, trong đó giun tròn ký sinh hoặc môi trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt sinh học hợp chất có Công thức 1, 1a, 1b hoặc 2, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa lượng hữu hiệu có tác dụng về mặt sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp sử dụng thuốc để điều trị cho người hoặc động vật.

Một hoặc nhiều phương pháp trong số các phương pháp và các dạng biến đổi sau như được mô tả trên các Sơ đồ từ 1–3 có thể sử dụng để điều chế hợp chất có công thức 1, 1a, 1b và 2. Định nghĩa về Q, R^{1a}, R^{1b}, R², R³ và R⁴ trong hợp chất có Công thức 2–8b dưới đây là như được xác định trên đây trong phần Bản chất kỹ thuật của sáng chế, trừ khi có quy định khác. Nhiệt độ trong phòng nằm trong khoảng từ 20 đến 25°C.

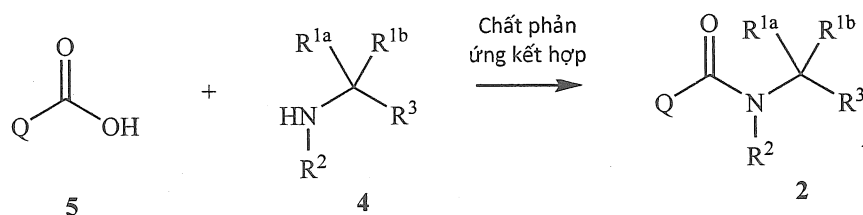
Hợp chất có Công thức 2 có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có Công thức 3, trong đó LG là nhóm rời chuyển như halogen, phản ứng với amit có Công thức

4 như được thể hiện trong Sơ đồ 1. Khi LG là halogen, phản ứng thường được thực hiện với sự có mặt của bazơ và trong dung môi thích hợp. Bazơ thích hợp bao gồm các amin như trietylamin, pyridin và picolin, muối kim loại vô cơ như cacbonat, bicarbonat, hydroxit và alkoxit, bao gồm natri và kali cacbonat, natri và kali bicarbonat, natri hydroxit và natri etoxit. Việc lựa chọn dung môi thích hợp sẽ phụ thuộc vào bản chất của LG, bazơ, và các điều kiện phản ứng được chọn. Dung môi thông thường bao gồm hydrocarbon béo như hexan, xyclohexan và heptan, hydrocarbon thơm như toluen và xylen, hydrocarbon được halogen hóa như diclometan, dicloetan và clobenzen, ete như dietyl ete, tetrahydrofuran, dioxan và dimetoxietan, este như etyl axetat, amit như DMF, DMAC và *N*-metylpyrrolidon, nitril như axetonitril, keton như axeton và MEK, và dung môi sinh proton phân cực như etanol và nước.

Sơ đồ 1

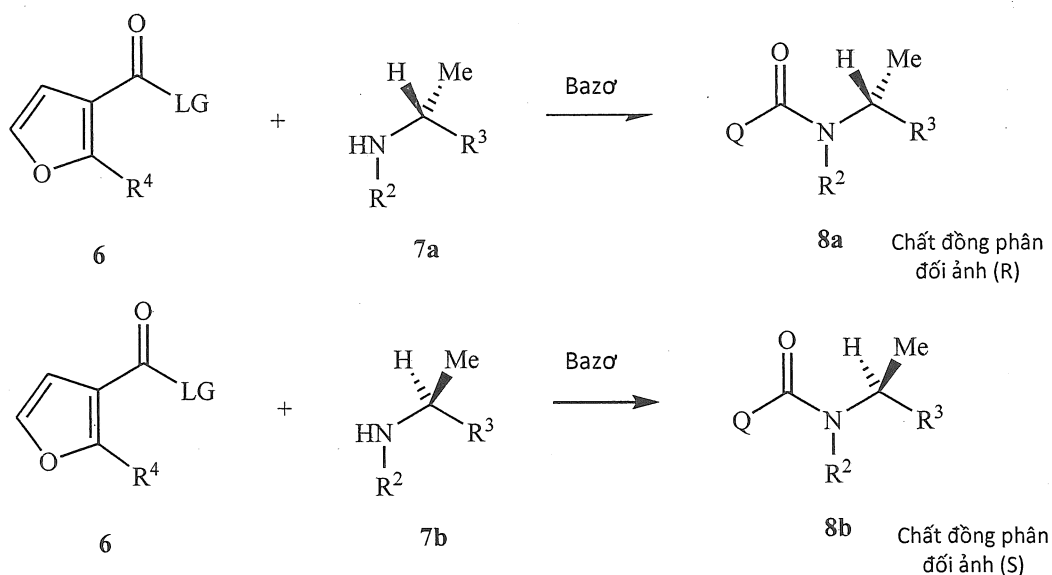


Hợp chất có Công thức 2 còn có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có Công thức 5 phản ứng với amit có Công thức 4 như được thể hiện trong Sơ đồ 2. Theo phương pháp này, chất phản ứng kết hợp amit như HATU (1-[bis(dimethylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridini 3-oxid hexaflophosphat), EDC (1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)carbodiimitt) được sử dụng. Các điều kiện phản ứng cho phản ứng kết hợp amit này là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

Sơ đồ 2

Hợp chất có Công thức 1 là nhóm con của hợp chất có Công thức 2, và có thể được điều chế theo cách được mô tả trên đây để điều chế hợp chất có Công thức 2.

Cấu trúc đồng phân đối ảnh có Công thức 1a và 1b có thể được điều chế như được thể hiện trong Sơ đồ 3 bằng các phương pháp và điều kiện tương tự với các phương pháp được mô tả trong Sơ đồ 1 và 2. Ví dụ, như được thể hiện trong Sơ đồ 3, kết hợp furan có Công thức 6 với amin không đối xứng có Công thức 7a hoặc 7b để lần lượt thu được hợp chất có Công thức 8a hoặc 8b. Các amin có Công thức 7a và 7b là có sẵn ở quy mô công nghiệp hoặc có thể được điều chế bằng cách phân giải không đối xứng amin racemic tương ứng bằng các phương pháp đã biết.

Sơ đồ 3

Theo cách khác, hợp chất có Công thức 1 có thể được điều chế dưới dạng hỗn hợp racemic, và hợp chất có Công thức 1a và 1b có thể được tách thành các chất đồng phân đối ảnh tương ứng của nó bằng phép sắc ký cột bất đối. Một lượng lớn cột bất đối đã có để tách thuộc loại này.

Hợp chất có Công thức 1, 1a, 1b và 2, trong đó R^2 không phải là H còn có thể được điều chế từ chất tương tự tương ứng của nó, trong đó R^2 là H nhờ phản ứng với alkyl, axyl được thể thích hợp hoặc chất phản ứng khác.

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

Người có hiểu biết trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng hợp chất có Công thức 1, 1a, 1b hoặc 2 và các sản phẩm trung gian được mô tả ở đây có thể tham gia vào các phản ứng ưa điện tử, ái nhân, gốc, kim loại hữu cơ, oxy hoá, và khử để bổ sung phần tử thế hoặc cải biến phần tử thế đang có.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Không cần mô tả chi tiết hơn, tin rằng người có hiểu biết trong lĩnh vực này bằng cách sử dụng phần mô tả trên đây có thể sử dụng sáng chế ở phạm vi rộng nhất của nó. Vì vậy, các Ví dụ tổng hợp sau chỉ minh họa và không giới hạn phần mô tả theo cách bất kỳ. Các bước trong các Ví dụ tổng hợp minh họa quy trình cho mỗi bước trong toàn bộ một quá trình chuyển hóa, và nguyên liệu ban đầu cho mỗi bước có thể không nhất thiết được điều chế bằng con đường điều chế cụ thể có quy trình được mô tả trong các Ví dụ hoặc Bước khác. Tỷ lệ phần trăm là khối lượng chỉ khác là hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc trừ khi có quy định khác. Các phần và tỷ lệ phần trăm của hỗn hợp dung môi sắc ký được tính theo thể tích, trừ khi có quy định khác. Phổ ^1H NMR được thông báo theo trường thấp ppm từ dung dịch tetrametylsilanin trong dimethylsulfoxit (d_6); “s” nghĩa là vạch đơn, “d” nghĩa là vạch đôi, “t” nghĩa là vạch ba, “m” nghĩa là đa vạch, “bm” nghĩa là đa vạch rộng, “dd” nghĩa là vạch đôi của vạch đôi, và “br s” nghĩa là vạch đơn rộng. Nhiệt độ trong phòng là nằm trong khoảng từ 20 đến 25°C. “DMF” là *N,N*-dimethylformamit.

Ví dụ tổng hợp 1

Điều chế 2-clo-*N*-[(1*S*)-1-xyclopropyletyl]-3-furancarboxamit và 2-clo-*N*-[(1*R*)-1-xyclopropyletyl]-3-furancarboxamit (hợp chất 11, 44 và 45)

Bước A: Điều chế axit 2-clo-3-furancarboxylic

n-BuLi 2,5M (6,5g, 102mmol) trong hexan ở -78°C được thêm vào dung dịch chứa diisopropylamin (10,3g, 102mmol) trong THF (20ml) và hỗn hợp phản ứng được làm ấm từ từ đến -40°C. Tiếp đó, axit 3-furancarboxylic (5g, 41mmol) trong THF (20ml) được thêm vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 30 phút. Hexacloetan (10,60g, 45,68mmol) trong THF (20ml) được thêm vào từ từ ở -78°C và hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 16 giờ. Phép phân tích TLC (5% MeOH trong DCM) thể hiện mức độ hoàn thành của phản ứng. Hỗn hợp phản ứng được làm lạnh đến 0°C, được tiêu bằng dung dịch HCl 1N, và được chiết bằng etyl axetat (3x). Lớp hữu cơ thu gom được rửa bằng nước muối và làm khô trên Na_2SO_4 . Dung môi được làm bay hơi dưới áp suất giảm và sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng cách rửa bằng dung môi để thu được 2,8g hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu nâu. ^1H

NMR (CDCl₃, 400 MHz): δ 10,2 (br s, 1H), 7,33 (d, 1H), 6,81 (d, 1H). Phổ khối: (M-1) = 145,

Bước B: Điều chế 2-clo-*N*-[(1*S*)-1-xyclopropyletyl]-3-furancarboxamit và 2-clo-*N*-[(1*R*)-1-xyclopropyletyl]-3-furancarboxamit

α -Metylxcyclopropanmetanamin hydroclorua (1:1) (0,75g, 6,16mmol), EDC-HCl (2g, 10,27mmol), DMAP (0,83g, 6,84mmol) được thêm vào dung dịch chứa axit 2-clo-3-furancarboxylic (1g, 6,84mmol) trong DCM (25ml), và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ phòng trong 6 giờ, sau thời điểm này phép phân tích TLC (50% etyl axetat trong ete dầu mỏ) thể hiện mức độ hoàn thành của phản ứng. Hỗn hợp phản ứng được tôi bằng nước và được chiết bằng etyl axetat (3x). Lốp hữu cơ thu gom được được rửa bằng nước, nước muối, và thì làm khô trên Na₂SO₄. Dung môi được làm bay hơi dưới áp suất giảm, và sản phẩm thô được tinh chế trên cột silicagel rửa giải bằng 20% etyl axetat/petroleum ete để thu được 0,7g hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng. ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): δ 7,31 (d, 1H), 6,82 (d, 1H), 6,19 (br s, 1H), 3,6 (m, 1H), 1,57 (d, 3H), 0,93 (m, 1H), 0,53 (m, 2H), 0,49 (m, 1H), 0,27 (m, 1H). Phổ khối: (M+1) = 214.

Chất đồng phân 1*S* và 1*R* được phân tách bằng phép HPLC điều chế bất đối, thu được hai chất đồng phân lập thể với góc quay quang $[\alpha]$ là -21,5 và + 21,2 (*c* 0,5, cloroform).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế 2-clo-*N*-(1,2,2-trimetylpropyl)-3-furancarboxamit (hợp chất 27)

Bước A: Điều chế 2-clo-3-furancarbonyl clorua

Trong môi trường nitơ, axit 2-clo-3-furancarboxylic (1,0g, 6,8mmol) được tạo huyền phù trong 100ml diclometan khan. Tiếp đó, oxalylclorua (0,98ml, 11,4mmol) được thêm vào, rồi thêm tiếp 1 giọt DMF. Hỗn hợp phản ứng được khuấy qua đêm, và dung môi tiếp đó được loại bỏ dưới áp suất giảm để thu được 852mg (76%) dầu màu vàng nâu. ¹H NMR (CDCl₃, 500 MHz): δ 7,37 (d, *J*=2,4 Hz, 1H), 6,89 ppm (d, *J*=2,2 Hz, 1H).

Dung dịch gốc được điều chế [75mg/5ml] trong diclometan sẽ được sử dụng trong các phản ứng tiếp theo.

Bước B: Điều chế 2-clo-*N*-(1,2,2-trimetylpropyl)-3-furancarboxamit

3-Amino-2,2-dimetylbutan (90 μ l, 0,67mmol) được thêm vào dung dịch chứa 2-clo-3-furancarbonyl clorua (100mg, 0,61mmol) trong 6,6ml diclometan khan trong môi trường nitơ. Tiếp đó, trietylamin (136 μ l, 0,98mmol) được thêm vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Dung dịch thu được này tiếp theo được rửa bằng nước, được cô với sự có mặt của Celite®, và được tinh chế bằng phép sắc ký (0-20% EtOAc:hexan) để thu được 64mg (46%) hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng dầu màu vàng nâu. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7,32 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,12-6,20 (m, 1H), 4,05 (dq, $J=9,5, 6,8$ Hz, 1H), 1,15 (d, $J=6,8$ Hz, 3H), 0,84-1,06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230,3,

Ví dụ tổng hợp 2a

Điều chế 2-clo-*N*-[(1*S*)-1,2,2-trimetylpropyl]-3-furancarboxamit (hợp chất 40)

Bước A: Điều chế 2-clo-*N*-[(1*S*)-1,2,2-trimetylpropyl]-3-furancarboxamit

(*S*)-(+)-3-amino-2,2-dimetylbutan (67 μ l, 0,50mmol) trong môi trường nitơ được thêm vào dung dịch chứa 2-clo-3-furancarbonyl clorua (75mg, 0,46mmol) trong 5ml diclometan khan. Tiếp đó, trietylamin (188 μ l, 1,35mmol) được thêm vào và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Dung dịch thu được này tiếp theo được rửa bằng nước, được cô với sự có mặt của Celite®, và được tinh chế bằng phép sắc ký (0-20% EtOAc:hexan) để thu được 33mg (31%) hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7,32 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,12-6,20 (m, 1H), 4,05 (dq, $J=9,5, 6,8$ Hz, 1H), 1,15 (d, $J=6,8$ Hz, 3H), 0,84-1,06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230,4, $[\alpha] +10,7^\circ$ (c 3,65, metanol).

Ví dụ tổng hợp 2b

Điều chế 2-clo-*N*-[(1*R*)-1,2,2-trimetylpropyl]-3-furancarboxamit (hợp chất 41)

Bước A: Điều chế 2-clo-*N*-[(1*R*)-1,2,2-trimetylpropyl]-3-furancarboxamit

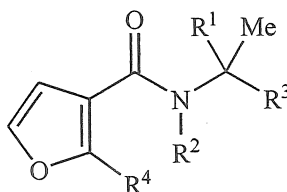
(*R*)-(+)-3-amino-2,2-dimetylbutan (67 μ l, 0,50mmol) được thêm vào dung dịch chứa 2-clo-3-furancarbonyl clorua (75mg, 0,46mmol) trong 5ml diclometan khan trong môi trường nitơ. Tiếp đó, trietylamin (188 μ l, 1,35mmol) được thêm vào và hỗn

hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Dung dịch thu được này tiếp theo được rửa bằng nước, được cô với sự có mặt của Celite®, và được tinh chế bằng phép sắc ký (0-20% EtOAc:hexan) để thu được 38mg (36%) hợp chất nêu ở đề mục này dưới dạng chất rắn màu trắng. ^1H NMR (CDCl_3 , 500MHz): δ 7,32 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J=2,2$ Hz, 1H), 6,12-6,20 (m, 1H), 4,05 (dq, $J=9,5, 6,8$ Hz, 1H), 1,15 (d, $J=6,8$ Hz, 3H), 0,84-1,06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z $[\text{M}+\text{H}]^+$: 230,3, $[\alpha]$ $-9,09^\circ$ (c 3,85, metanol).

Hợp chất cụ thể có Công thức 1, 1a, 1b hoặc 2, được điều chế bằng các phương pháp và biến thể như được mô tả trong các Sơ đồ từ 1 đến 3 và các Ví dụ tổng hợp 1, 2, 2a và 2b trên đây, sẽ được thể hiện trong Bảng chỉ số dưới đây. Các chữ viết tắt sau đây có thể sẽ được sử dụng: Cmpd là Hợp chất, t là bậc ba, Me là methyl, và Et là etyl. "-" trong đoạn cấu trúc để chỉ điểm gắn của đoạn này với phần còn lại của phân tử. Chữ viết tắt "Ví dụ" là "Ví dụ" và được tiếp theo bằng số chỉ Ví dụ tổng hợp mà hợp chất được điều chế.

Cột có tiêu đề "MS" chứa dữ liệu về phổ khối. Cột có tiêu đề "MP" chứa dữ liệu về khoảng nóng chảy. Trong các trường hợp mà cột duy nhất có tiêu đề "MS/MP", dữ liệu trong cột này sẽ chứa khoảng (ví dụ, 120-122) là khoảng nóng chảy, là khoảng điểm nóng chảy, trong khi dữ liệu trong cột này chứa số đơn (ví dụ, 208,1) là dữ liệu khối phổ. Đối với dữ liệu khối phổ, giá trị chính xác được báo cáo là khối lượng phân tử của ion phân tử quan sát được bằng cách bổ sung H^+ (phân tử lượng bằng 1) vào phân tử có độ giàu đồng vị lớn nhất (tức là M). Các đỉnh khối phổ được báo cáo quan sát được bằng cách sử dụng phương pháp ion hóa bằng hóa học tại áp suất khí quyển (AP^+).

1) Bảng chỉ số A

 R^4 là Me

Hợp chất số	R^1	R^2	R^3	MS	MP
1	H	H	-CH(Me)Et		75-78
2	H	Me	xyclopropyl	208,1	
3	H	H	metyl		80-83
4	H	H	isopropyl		68-71
5	H	H	propyl	*	*
6	H	H	xyclopropyl		64-68
7	Me	H	xyclopropyl		78-82
80	H	H	-CH ₂ C(Me) ₃		104-108

 R^4 là Cl

Hợp chất số	R^1	R^2	R^3	MS	MP
8	Me	H	xyclopropyl		62-63
9	H	H	-CH ₂ CH ₂ (xyclopropyl)	242,1	
10	Me	H	isopropyl	230,3	
11 (Ví dụ 1)	H	H	xyclopropyl		82-86
12	Me	H	-CH ₂ OMe	*	*
13	H	H	-CH ₂ OMe		55-56
14	Me	H	-CH ₂ SMe		59-60
15	Me	H	-CH ₂ SO ₂ Me		100-101
16	H	H	etyl		85-86
17	H	H	propyl	*	*
18	Me	H	-CH ₂ C(Me) ₃	*	*
19	H	H	-CH ₂ CH(Me) ₂	230,3	
20	H	H	xyclopentyl	242,4	
21	H	H	xyclohexyl	256,4	
22	H	H	1-metyl xyclopropyl	228,3	
23	H	H	xyclobutyl	228,3	
24	H	H	-CF ₃	242,3	
25	Me	H	-CH ₂ S(O)Me		134-135
26	H	H	isopropyl		81-84
27 (Ví dụ 2)	H	H	<i>t</i> -butyl	230,4	
28	H	H	-CH ₂ SMe	234,3	
29	H	H	pentyl	244,4	
30	H	H	4-metyl pentyl	258,4	
31	H	Me	xyclopropyl	229,2	

78	H	H	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	244,3	
----	---	---	-------------------------------------	-------	--

R^4 là Br

Hợp chất số	R^1	R^2	R^3	MS	MP
32	H	H	cyclopropyl		54-57
33	H	H	isopropyl		58-59
34	H	H	propyl	*	*
35	H	H	<i>t</i> -butyl	*	*

R^4 là CN

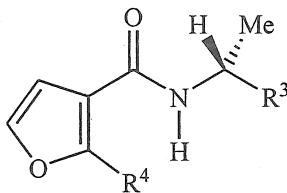
Hợp chất số	R^1	R^2	R^3	MS
79	H	H	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{Et}$	235,2
97	H	H	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	*
98	H	H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})_2$	*

R^4 là I

Hợp chất số	R^1	R^2	R^3	MS	MP
83	H	H	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$		68-72
88	H	H	<i>t</i> -butyl	322,4	

* Xem Bảng chỉ số D đối với dữ liệu ^1H NMR.

2) Bảng chỉ số B-1

 R^4 là Me

Hợp chất số	R^3	MP	Quay quang
36	xyclopropyl	70-73	
39	<i>t</i> -butyl	63-64	
84	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	130-134	-30,35 (<i>c</i> 0,1, cloroform)
96	isopropyl	51-55	

 R^4 là Cl

Hợp chất số	R^3	MS	MP	Quay quang
41 (Ví dụ 2b)	<i>t</i> -butyl	230,3		-9,09 (<i>c</i> 3,85, metanol)
45 (Ví dụ 1)	xyclopropyl		144-148	-21,5 (<i>c</i> 0,1, cloroform)
75	isopropyl	216,1		-20,0 (<i>c</i> 0,1, cloroform)
76	ethyl		64-65	

 R^4 là Br

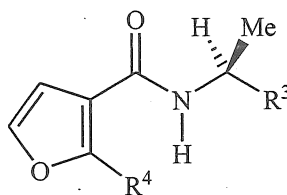
Hợp chất số	R^3	MP	Quay quang
38	<i>t</i> -butyl	89-90	
74	xyclopropyl	70-73	

 R^4 là I

Hợp chất số	R^3	MS	MP	Quay quang
86	<i>t</i> -butyl	322,1		-12,66 (<i>c</i> 0,4, cloroform)
102	$-\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$		94-98	-22,8 (<i>c</i> 0,25, cloroform)

3)

4) Bảng chỉ số B-2

R⁴ là Me

Hợp chất số	R ³	MS	MP	Quay quang
37	xyclopropyl		70-73	
85	-CH ₂ C(Me) ₃		132-136	+23,62 (c 0,25, cloroform)
94	<i>t</i> -butyl	213,4		
101	isopropyl		53-54	

R⁴ là Cl

Hợp chất số	R ³	MS	MP	Quay quang
40 (Ví dụ 2a)	<i>t</i> -butyl	230,4		+10,7 (c 3,65, metanol)
43	isopropyl	*	*	+22,0 (c 0,1, cloroform)
44 (Ví dụ 1)	xyclopropyl		81-85	+21,2 (c 0,1, cloroform)
77	ethyl		64-65	

R⁴ là Br

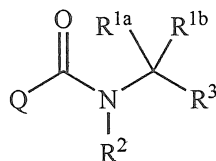
Hợp chất số	R ³	MP	Quay quang
42	<i>t</i> -butyl	90-91	
73	xyclopropyl	71-75	

R⁴ là I

Hợp chất số	R ³	MS	MP	Quay quang
87	<i>t</i> -butyl	322,1		+19,2 (c 0,5, cloroform)
103	-CH ₂ C(Me) ₃		92-96	+11,2 (c 0,25, cloroform)

* Xem Bảng chỉ số D đối với dữ liệu ¹H NMR.

5) Bảng chỉ số C-1

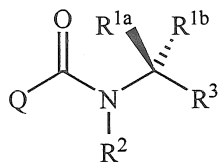
 R^2 là H

Hợp chất số	Q	R^{1a}	R^{1b}	R^3	MS/MP
46	2-metyl-3-furanyl	xyclopropyl	H	xyclopropyl	110-115
47	2-metyl-3-furanyl	-CH ₂ CH ₂ -		xyclopropyl	*
48	3-metyl-2-thienyl	Me	H	isopropyl	84-88
49	3-flo-2-thienyl	Me	H	xyclopropyl	72-76
50	3-bromo-2-thienyl	Me	H	xyclopropyl	41-44
51	2-clo-3-furanyl	-CH ₂ CH ₂ -		xyclopropyl	82-83
52	3-metyl-2-thienyl	xyclopropyl	H	xyclopropyl	121-125
53	2-clo-3-furanyl	etyl	H	xyclopropyl	74-77
54	2-clo-3-furanyl	etyl	H	-CH ₂ OMe	54-55
55	5-iodo-2-metyl-4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	337,3
56	5-iodo-4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	323,3
57	2-clo-4-iodo-5-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	357,2
58	3-metylthio-2-thienyl	metyl	H	xyclopropyl	242,3
59	2-bromo-5-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	277,2
60	2-metyl-5-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	211,3
61	5-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	197,3
62	5-clo-4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	231,3
63	5-bromo-4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	275,2
64	3-metoxo-2-thienyl	metyl	H	xyclopropyl	60-62
65	3-(triflometyl)-2-thienyl	metyl	H	xyclopropyl	65-68
66	2-clo-3-furanyl	xyclopropyl	H	triflometyl	101-106
67	2-metyl-3-furanyl	etyl	H	xyclopropyl	76-80
68	3-clo-2-thienyl	xyclopropyl	H	xyclopropyl	160-164
69	2-thienyl	metyl	H	xyclopropyl	143-146
70	4-metyl-5-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	211,4
71	4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	197,3
72	5-(triflometyl)-4-thiazolyl	metyl	H	xyclopropyl	265,3
82	4-metyl-5-thiazolyl	metyl	H	<i>t</i> -butyl	114-118
89	3-(1,1-dimetyletyl)-2-thienyl	metyl	H	isopropyl	67-68
90	3-(1,1-dimetyletyl)-2-thienyl	metyl	H	<i>t</i> -butyl	68-69

93	5-bromo-4-thiazolyl	metyl	metyl	-CH ₂ OMe	293,2
99	2-metyl-3-furanyl	<i>t</i> -butyl	H	<i>t</i> -butyl	285,1

* Xem Bảng chỉ số D đối với dữ liệu ¹H NMR.

6) Bảng chỉ số C-2



R² là H

Hợp chất số	Q	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	MS/MP	Quay quang
81	4-metyl-5-thiazolyl	Me	H	<i>t</i> -butyl	125-129	+33,9 (<i>c</i> 0,1, cloroform)
91	3-(1,1dimetyletyl)-2-thienyl	H	Me	<i>t</i> -butyl	42-43	-33,1 (<i>c</i> 0,8, cloroform)
92	3-(1,1dimetyletyl)-2-thienyl	Me	H	<i>t</i> -butyl	54-55	+17,3 (<i>c</i> 0,79, cloroform)
95	3-xyano-2-thienyl	Me	H	<i>t</i> -butyl	237,3	+26,4 (<i>c</i> 0,78, cloroform)
100	4-metyl-3-thienyl	Me	H	<i>t</i> -butyl	210,3	-35,1 (<i>c</i> 0,77, cloroform)

Bảng chỉ số D

Hợp chất số	Dữ liệu ^1H NMR ^a
5	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,26 (s, 1H), 6,41 (s, 1H), 5,44 (br s, 1H), 4,15 (m, 1H), 2,58 (s, 3H), 1,50 (m, 2H), 1,30 (m, 2H), 1,20 (d, 3H), 0,93 (t, 3H),
12	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,29 (d, 1H), 6,78 (s, 1H), 6,50 (br s, 1H), 3,41 (s, 3H), 3,41 (s, 2H), 1,45 (s, 6H),
17	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,31 (s, 1H), 6,82 (s, 1H), 6,00 (br s, 1H), 4,18 (m, 1H), 1,5 (m, 2H), 1,30 (m, 2H), 1,22 (d, 1H), 0,95 (t, 3H),
18	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,31 (s, 1H), 6,82 (s, 1H), 6,20 (br s, 1H), 1,85 (s, 2H), 1,50 (s, 6H), 1,02 (s, 9H),
34	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,45 (s, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,05 (br s, 1H), 4,18 (m, 1H), 1,50 (m, 2H), 1,30 (m, 2H), 1,23 (d, 3H), 0,95 (t, 3H),
35	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,46 (s, 1H), 6,87 (s, 1H), 6,22 (br s, 1H), 4,07 (m, 1H), 1,17 (d, 3H), 0,97 (d, 6H),
43	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,32 (s, 1H), 6,84 (s, 1H), 6,25 (br s, 1H), 4,06 (m, 1H), 1,79 (m, 1H), 1,17 (d, 3H), 0,96 (d, 6H),
47	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,08 (s, 1H), 6,23 (s, 1H), 6,00 (br s, 1H), 2,42 (s, 3H), 1,35 (m, 1H), 0,60 (m, 2H), 0,50 (m, 2H), 0,28 (m, 2H), 0,02 (m, 2H),
97	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,46 (s, 1H), 6,47 (s, 1H), 5,24 (br s, 1H), 4,13 (m, 1H), 1,49-1,42 (m, 2H), 1,24-1,19 (m, 3H), 0,95 (s, 9H),
98	^1H NMR (CDCl_3) δ 7,42 (s, 1H), 6,59 (br s, 1H), 4,24-4,20 (m, 1H), 1,63 (m, 1H), 1,55-1,44 (m, 1H), 1,35-1,28 (m, 1H), 1,21 (d, 3H), 0,92-0,91 (m, 6H),

Dữ liệu ^1H NMR ở phần triệu (ppm) giảm từ tetrametylsilan. Việc kết hợp được ký hiệu bằng: vạch đơn (s), vạch đơn rộng (br s), vạch đôi (d), vạch ba (t), vạch đa (m), vạch đôi của vạch đôi (dd), vạch đôi của vạch ba (dt), vạch rộng (br).

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

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

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

Chế phẩm dạng phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn như vậy được pha chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước, nhưng đôi khi là môi trường thích hợp khác như hydrocacbon thơm hoặc parafin hoặc dầu thực vật. Lượng dung dịch để phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thường là nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Chế phẩm phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng.

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

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

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

Chất pha loãng dạng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-dimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-dimetylformamit), limonen, dimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyroliton (ví dụ, *N*-metylpyrolitinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen carbonat, butylen carbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triaxetin, hydrocacbon thơm, chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như este lactat alkylat hóa, este dibazơ và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-etylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu tridexylic, rượu olylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, rượu diaxeton và rượu benzylic.

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

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

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

các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyl (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt nền silic; và dẫn xuất của đường như este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysaccarit.

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

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

Cũng hữu dụng đối với các chế phẩm theo sáng chế là hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, Ấn phẩm hàng năm của Mỹ và quốc tế do

McCutcheon's Division xuất bản, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Enxyclopedia of Surfaxe Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

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

Hợp chất có Công thức 1, 1a, 1b hoặc 2 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được đưa vào các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng dạng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc dễ nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới 2,000 μm có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới 3 μm . Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem, U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để thu được hạt phân tán trong nước. Chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường

kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới 10 μm . Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem, Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry’s Chemical Engineer’s Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và sau đó, và WO 91/13546. Dạng viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các phương pháp điều chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture” 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 trong U.S. 3,235,361, cột 6, dòng 16 đến cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, dòng 43 đến cột 7, dòng 62 và các Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến cột 5, dòng 17 và các Ví dụ 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, trang 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in Formulation Technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

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

Ví dụ AChế phẩm cô đặc có nồng độ cao

hợp chất 9	98,5%
silic oxit aerogel	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%

Ví dụ BBột thấm ướt

hợp chất 11	65,0%
dodexylphenol polyetylen glycol etc	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
monmorilonit (nung)	23,0%

Ví dụ C(1) Dạng hạt

hợp chất 26	10,0%
hạt atapulgit (chất bay hơi thấp 0,71/0,30mm; hạt đi qua rây Mỹ cỡ số 25–50)	90,0%

Ví dụ DViên ép đùn

hợp chất 40	25,0%
-------------	-------

natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ EChế phẩm cô đặc dễ nhũ hóa

hợp chất 43	10,0
	%
polyoxyetylen sorbitol hexolat	20,0
	%
este của axit béo C6–C10 metyl	70,0
	%

Ví dụ FVi nhũ tương

hợp chất 78	5,0%
polyvinylpyroliton-vinyl axetat copolyme	30,0
	%
Alkylpolyglycosit	30,0
	%
glyxeryl monoolat	15,0
	%

nước	20,0
	%

Ví dụ GXử lý hạt

hợp chất 80	20,00
	%

polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat copolyme	5,00
	%

sáp axit montan	5,00
	%

canxi ligninsulfonat	1,00
	%

copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00
	%

rượu stearyllic (POE 20)	2,00
	%

Polyorganosilan	0,20
	%

thuốc nhuộm màu đỏ	0,05
	%

nước	65,75
	%

Ví dụ HThành phần bón

hợp chất 84	2,5%
pyrolidon-styren copolyme	4,8%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,3%
bột talc	0,8%
tinh bột ngô	5,0%
phân bón giải phóng chậm Nitrophoska®	36,0
Permanent 15-9-15 (BASF)	%
caolanh	38,0
	%
nước	10,6
	%

Ví dụ IHuyền phù đặc

hợp chất 9	35%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%

chất khử bọt nền silic	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
nước	53,7
	%

Ví dụ JNhũ tương trong nước

hợp chất 11	10,0
	%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt nền silic	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon nền dầu mỏ thơm	20,0
nước	58,7
	%

Ví dụ KChất phân tán dạng dầu

hợp chất 26	25%
-------------	-----

polyoxyetylen sorbitol hexaolat	15%
Đất sét bentonit được cải biến bằng hữu cơ	2,5%
metyl este của axit béo	57,5
	%

Ví dụ LSiêu nhũ tương

hợp chất 40	10,0
	%
imidacloprid	5,0%
copolyme khối butyl	4,0%
polyoxyetylen/polypropylen	
axit stearic/polyetylen glycol copolyme	1,0%
styren acrylic polyme	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt nền silic	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon nền dầu mỏ thơm	20,0
	%
nước	53,7
	%

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

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể tùy ý chứa các chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ, phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn từ nitơ, phospho,

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

Hợp chất theo sáng chế có thể có hoạt tính với phổ rộng của giun tròn ký sinh sống hoặc sinh trưởng bên trong hoặc ăn thực vật (ví dụ, lá, quả, chồi, rễ hoặc hạt) hoặc động vật và người (ví dụ, hệ mạch hoặc hệ tiêu hóa hoặc các mô khác) và vì vậy phá hại sự sinh trưởng và bảo quản cây trồng nông nghiệp, lâm nghiệp, cây trồng nhà kính, cây trồng làm cảnh và cây trồng vườn ươm, hoặc gây ảnh hưởng đến sức khỏe của người và động vật. Các cây trồng được quan tâm cụ thể là rau quả như cây trồng họ cà và họ bầu bí, cây trồng vườn ươm như chuối và cà phê, cây trồng dạng rễ như khoai tây, hành và cà rốt, và cây trồng nông nghiệp như cây thuốc lá, cây đậu phộng, cây bông, cây mía và cây đậu tương.

Hợp chất theo sáng chế cũng có hoạt tính đối với các loài thuộc cả hai lớp Adenophorea và Secernentea của ngành giun tròn Phylum Nematoda, bao gồm các loài có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế của bộ Enoplida, Dorylaimida, Rhabditida, Strongylida, Ascarida, Oxyurida, Spirurida, Tylenchida và Aphelenchida, như nhưng không chỉ giới hạn ở các loài gây hại trong nông nghiệp có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế như giun tròn gây sần rễ thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây nang thuộc giống *Heterodera* và *Globodera*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn dạng thoi thuộc giống *Rotylenchulus*, giun tròn tạo hang thuộc giống *Radopholus*, giun tròn chích thuộc giống *Belonolaimus*, giun tròn dạng xoắn ốc thuộc giống *Helicotylenchus* và *Scutellonema*, giun tròn giống cam quýt thuộc giống *Tylenchulus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus* và *Paratrichodorus*, giun tròn hình dao

găm thuộc giống *Xiphinema*, giun tròn gây căn cổ thuộc giống *Tylenchorhynchus*, giun tròn hình kim thuộc giống *Longidorus* và *Paralongidorus*, giun tròn chích thuộc giống *Hoplolaimus*, giun tròn hình vòng thuộc họ Criconematidae, giun tròn hình cuống thuộc giống *Ditylenchus* và *Anguina*, và giun tròn lá/cuống thuộc giống *Aphelenchoides* và *Rhadinaphelenchus*; và các loài ký sinh gây ảnh hưởng đến sức khỏe người và động vật (tức là, giun tròn có ảnh hưởng có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara canis* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis* ở chó, v. v...).

Đáng lưu ý là việc sử dụng hợp chất theo sáng chế để phòng trừ giun tròn gây sần rỗ phương nam (*Meloidogyne incognita*). Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này cần phải hiểu rằng không phải tất cả các hợp chất đều có hiệu quả như nhau trong tất cả các giai đoạn sinh trưởng của tất cả giun tròn.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể có hoạt tính với các loài thuộc Phylum Platyhelminthes, lớp Cestoda (Tapeworms) và Trematoda (Flukes), bao gồm các loài ký sinh (tức là, sán lá và sán dây có ảnh hưởng có ảnh hưởng lớn về mặt kinh tế) gây ảnh hưởng xấu đến sức khỏe động vật và người (ví dụ, *Anoplocephala perfoliata* ở ngựa, *Fasciola hepatica* ở động vật nhai lại, v. v...).

Các hợp chất theo sáng chế cũng có thể được trộn với một hoặc một số chất hoặc hoạt chất sinh học bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ, chất tăng cường độ tương thích của cây trồng cho thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế côn trùng lột xác và chất kích thích rễ, thuốc tiết dục, chất bán hoá học, chất xua đuổi, chất hấp dẫn côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học hoặc vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus hoặc nấm để tạo thành thuốc trừ sâu nhiều thành phần có phổ sử dụng trong nông nghiệp và phi nông nghiệp rộng hơn. Do đó, sáng chế cũng đề xuất chế phẩm chứa hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, và lượng hữu hiệu của ít nhất một chất hoặc hoạt chất sinh học bổ sung và có thể chứa thêm ít nhất một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn hoặc chất pha loãng lỏng. Đối với hỗn hợp theo sáng chế, các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế cùng với hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, để tạo thành hỗn hợp sơ chế, hoặc các chất hoặc hoạt chất sinh học khác có thể được điều chế riêng lẻ từ hợp chất theo sáng chế, bao gồm các hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, và hai chế phẩm

được kết hợp cùng nhau trước khi sử dụng (ví dụ, trong thùng phun) hoặc, theo một cách khác, được dùng liên tiếp.

Ví dụ về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể chế hoá với hợp chất theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, axephat, axequinoxyl, 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*-decahydro-6,12-dihydroxy-4,6*a*,12*b*-trimethyl-11-oxo-9-(3-pyridinyl)-2*H*,11*H*-naphtho[2,1-*b*]pyrano[3,4-*e*]pyran-4-yl]methyl xyclopropanecarboxylat), amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazat, bistrifluron, borat, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, cloantraniliprol, clofenapyr, clofluzuron, clopyrifos, clopyrifos-methyl, chromafenozit, clofentezin, clothianidin, xyantraniliprol (3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xyclaniliprol (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropylethyl)amino]carbonyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xycloprothrin, xycloxaprid ((5*S*,8*R*)-1-[(6-clo-3-pyridinyl)methyl]-2,3,5,6,7,8-hexahydro-9-nitro-5,8-epoxy-1*H*-imidazo[1,2-*a*]azepin), xyflumetofen, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, 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-ethyl-3,7-dimethyl-6-[4-(triflometoxy)phenoxy]-4-quinolinyl methyl cacbonat), flonicamid, flubendiamit, fluxythrinat, flufenrim, flufenoxuron, flufenoxystrobin (methyl (α *E*)-2-[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]methyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat), fluensulfon (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-methyl-2-propen-1-yl)amino]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-carbonitril), flupyradifurone (4-[(6-clo-3-pyridinyl)methyl](2,2-difloetyl)amino]-2(5*H*)-furanone), fluvalinat, tau-fluvalinat, fonophos, formetanat, fosthiazat, halofenozit, heptafluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]methyl 2,2-dimethyl-3-[(1*Z*)-3,3,3-triflo-1-propen-1-yl]xyclopropanecarboxylat), hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid,

indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl (1*R*,3*S*)-3-(2,2-dicloethenyl)-2,2-dimetylxcyclopropancooxylat), metaflumizon, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiocarb, metomyl, metopren, metoxyclo, metoxyfenozit, metofluthrin, monocrotophos, monoflothin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 3-(2-xyano-1-propen-1-yl)-2,2-dimetylxcyclopropancooxylat), nicotin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbut, pyflubumide (1,3,5-trimetyl-*N*-(2-metyl-1-oxopropyl)-*N*-[3-(2-metylpropyl)-4-[2,2,2-triflo-1-metoxi-1-(triflometyl)etyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-4-carboxamit), pymetrozin, pyrafluprol, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin (metyl (α *E*)-2-[[[2-[(2,4-diclophenyl)amino]-6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl]oxy]metyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat), pyriprol, pyriproxifen, rotenon, ryanodin, silafluofen, spintoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflo (*N*-[metyloxido[1-[6-(triflometyl)-3-pyridinyl]etyl]- λ^4 -sulfanyliden]xyanamit), tebufenozit, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetraclovinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2,3,3-tetrametylxcyclopropancooxylat), tetraniliprol, thiadoclopid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tioazafen (3-phenyl-5-(2-thienyl)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpyrad, tralomethrin, triazamat, triclofon, triflumezopyrim (2,4-dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidinium inner salt), triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, vi khuẩn gây chết cho côn trùng, virus gây chết cho côn trùng và nấm gây chết cho côn trùng.

Đáng lưu ý là thuốc trừ sâu như abamectin, axetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, cloantraniliprol, clofenapyr, clopyrifos, clothianidin, xyantraniliprol, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazat, hexaflumuron, hydrametylnon, imidaclopid,

indoxacarb, lufenuron, metaflumizon, methiodicarb, methomyl, methopren, metoxyfenozit, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodin, spintoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, tebufenozit, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamat, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, toàn bộ chủng của *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng của virus *Nucleo polyhydrosis*.

Một phương án của chất sinh học để trộn với hợp chất theo sáng chế bao gồm vi khuẩn gây chết cho côn trùng như *Bacillus thuringiensis* và nội độc tố delta được bao nang của *Bacillus thuringiensis* như thuốc trừ sâu sinh học MVP[®] và MVPII[®] được điều chế bằng cách quy trình CellCap[®] (CellCap[®], MVP[®] và MVPII[®] là nhãn hiệu hàng hoá của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); nấm gây chết cho côn trùng như nấm nhò xạ xanh; và virus gây chết cho côn trùng (cả hai trong tự nhiên và biến đổi gen) như virus hình que, virus nhiều mặt nhân (nucleopolyhedro virus - NPV) như HZNPV (*Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus), AfNPV (*Anagrapha falcifera* nucleopolyhedrovirus); và (granulosis virus-GV) như virus dạng hạt *Xydia pomonella* (CpGV).

Tốt hơn, nếu chế phẩm, trong đó hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống khác thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác với hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b. Trong một số trường hợp, chế phẩm với ít nhất một phòng trừ hoạt chất loài gây hại không xương sống khác có phổ phòng trừ tương tự nhưng vị trí tác động khác nhau sẽ được ưu tiên đặc biệt. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa thêm ít nhất một hoạt chất phòng trừ loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ phòng trừ tương tự nhưng thuộc về nhóm hoá chất khác nhau hoặc có vị trí tác động khác nhau. Hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE) như carbamat metomyl, oxamyl, thiodicarb, triazamat, và organophosphat clopyrifos; GABA (axit γ -aminobutyric)-chất đối kháng kênh clorua cửa như xyclodiens dieldrin và endosulfan, và phenylpyrazol ethiprol và fipronil; chất điều biến kênh natri như pyrethroid bifenthrin, xyfluthrin, *beta*-xyfluthrin, xyhalothrin, *lambda*-xyhalothrin, xypermethrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerat, metofluthrin và profluthrin; chất chủ vận thụ

thể nicotinic axetylcholin (nAChR) như neonicotinoit axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazin, thiacloprid, và thiametoxam, và sulfoxaflor; chất hoạt hóa dị lập thể thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR) như spinosyn spintoram và spinosad; chất hoạt hóa kênh clorua như avermectin abamectin và emamectin; chất bắt chước hormon trưởng thành như diofenolan, metopren, fenoxycarb và pyriproxyfen; chất phong bế nuôi dưỡng homopteran chọn lọc như pymetrozin và flonicamid; chất ức chế tăng trưởng khi nhỏ như etoxazol; chất ức chế syntaza ATP thể hạt sợi như propargit; chất gỡ bỏ sự phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách phá vỡ gradien proton như clofenapyr; chất phong bế kênh thụ thể nicotinic axetylcholin (nAChR) như chất tương tự nereistoxin cartap; chất ức chế sinh tổng hợp chitin như benzoylureas flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron, và buprofezin; chất cản trở rụng lông dipteran như xyromazin; chất chủ vận thụ thể ecdyson như diaxylhydrazin metoxyfenozit và tebufenozit; chất chủ vận thụ thể octopamin như amitraz; chất ức chế vận chuyển electron phức thể hạt sợi III như hydrametylnon; chất ức chế vận chuyển electron phức thể hạt sợi I như pyridaben; chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thể như indoxacarb; chất ức chế axetyl CoA carboxylaza như axit tetronic và tetramic spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat; chất ức chế vận chuyển electron phức thể hạt sợi II như β -ketonitril xyenopyrafen và xyflumetofen; chất điều biến thụ thể ryanidin như anthranilic diamit cloantraniliprol, xyantraniliprol và xyantraniliprol, diamit như flubendiamit, và phối tử thụ thể ryanodin như ryanodin; hợp chất, trong đó vị trí đích chịu trách nhiệm về hoạt tính sinh học là không được biết hoặc không đặc trưng như azadirachtin, bifenazat, pyridalyl, pyrifluquinazon và triflumezopyrim; chất làm phá vỡ vi khuẩn có màng thành côn trùng như *Bacillus thuringiensis* và delta-endotoxin mà chúng tạo ra và *Bacillus sphaericus*; và các tác nhân sinh học bao gồm virus nhân đa diện (NPV) và virus có khả năng trừ sâu khác trong tự nhiên hoặc biến đổi gen.

Ví dụ khác về hợp chất hoặc chất có hoạt tính sinh học có thể chế hoá được với hợp chất theo sáng chế là: thuốc 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, betoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen,

blasticidin-S, boscalid, bromuconazol, bupirimat, buthiobat, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, clozolinat, đồng hydroxit, đồng oxyclorua, đồng sulfat, coumoxystrobin, xyazofamid, xyflufenamid, xymoxanil, xyproconazol, xyprodinil, diclofluanid, dicloxymet, diclomezin, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimethirimol, dimetomorph, dimoxystrobin, diniconazol (bao gồm diniconazol-M), dinocap, dithianon, dithiolans, dodemorph, dodin, econazol, etaconazol, edifenphos, enoxastrobin (còn được biết là enstroburin), epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, etridiazol, famoxadon, fenamidon, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fencpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferimzon, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxystrobin, flumorph, fluopicolide, fluopyram, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamid, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fthalide (còn được biết là phtalua), 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, manb, mapanipyrin, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl (bao gồm metalaxyl-M/mefenoxam), metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenon, myclobutanil, naftitin, neo-asozin (ferric metanarsonat), nuarimol, octhilinon, ofuraxe, hoặcxysastrobin, oxadixyl, oxathiapiprolin, axit oxolinic, oxpoconazol, oxycarboxin, oxytetracyclin, penconazol, penxycuron, penflufen, pen thiopyrad, perfurazoat, axit phosphorơ (bao gồm muối của nó, ví dụ, fosetyl-aluminm), picarbutratox, picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazol, procloaz, proxymidon, propamocarb, propiconazol, propinb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazol, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributacarb, pyrifenox, pyrioferon, perisoxazol, pyrimetanil, pyrifenox, pyrolnitrin, pyroquilon, quinconazol, quinmethionat, quinoxifen, quintozen, silthiofam, sedaxan, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, sulfur, tebuconazol, tebufloquin, teclofthalam, tecloftalam, tecnazen, terbinafin, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamid, thiophanat, thiophanat-metyl, thiram, tiadinil, tolclofos-metyl, tolprocarb, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, sulfat đồng tribazơ, triclopyricarb, tridemorph, trifloxystrobin,

triflumizol, trimopramit trixyclozol, triforin, triticonazol, uniconazol, validamycin, valifenalat (còn được biết là valifenal), vinclozolin, zinb, ziram và zoxamit; thuốc diệt giun tròn như fluopyram, spirotetramat, thiodicarb, fosthiazat, abamectin, iprodion, fluensulfon, dimethyl disulfua, tioxazafen, 1,3-diclopropen (1,3-D), metam (natri và kali), dazomet, clopicrin, fenamiphos, etoprophos, cadusaphos, terbufos, imixyafos, oxamyl, carbofuran, tioxazafen, *Bacillus firmus* và *Pasteuria nishizawae*; thuốc sát trùng như streptomycin; thuốc diệt bọ ve như amitraz, chinomethionat, clobenzilat, xyhexatin, dicofol, dienoclo, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximat, hexythiazox, propargite, pyridaben và tebufenpyrad.

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

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

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

Đối với các phương án, trong đó một hoặc nhiều các thành phần trộn khác nhau này được sử dụng, tỷ lệ trọng lượng của các thành phần trộn khác nhau này (tổng số) với hợp chất có Công thức 1 thường nằm trong khoảng từ 1:3000 đến 3000:1.

Đáng lưu ý là tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:300 đến 300:1 (ví dụ, tỷ lệ nằm trong khoảng từ 1:30 đến 30:1). Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể xác định một cách dễ dàng bằng cách thử nghiệm một cách đơn giản lượng hữu hiệu sinh học của hoạt chất cần để có phổ hoạt tính sinh học mong muốn. Điều hiển nhiên là việc đưa các thành phần bổ sung này vào có thể mở rộng phổ phòng trừ giun tròn ký sinh vượt trội hơn phổ phòng trừ của riêng hợp chất Có công thức 1.

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

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

Để đạt được việc tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế để bảo vệ cây trồng khỏi giun tròn ký sinh, hợp chất hoặc chế phẩm thường được áp dụng cho hạt của cây trước khi trồng, cho lá (ví dụ, lá, thân, hoa, quả) của cây trồng hoặc cho đất hoặc môi trường phát triển khác trước khi hoặc sau khi cây được trồng.

Theo một phương án thực hiện, phương pháp tiếp xúc là bằng cách phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng hạt chứa hợp chất theo sáng chế có thể được phun lên tán lá hoặc vào đất. Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được chuyển vận một cách hiệu quả qua sự hấp thụ của cây bằng cách cho cây tiếp xúc với chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế được phun vào đất ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất, chế phẩm dạng hạt, xử lý vườn ươm hoặc ngâm mảnh cây ghép. Tốt hơn là, chế phẩm theo sáng chế ở dạng chế phẩm lỏng tưới đất. Tốt hơn nữa là, phương pháp phòng trừ giun tròn ký sinh

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

Hợp chất theo sáng chế là cũng có thể sử dụng để xử lý hạt để bảo vệ hạt khỏi giun tròn ký sinh. Trong bản mô tả này, xử lý hạt có nghĩa là cho hạt tiếp xúc với lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo sáng chế, mà nó thường được chế hoá dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Việc xử lý hạt này bảo vệ hạt khỏi loài loài gây hại không xương sống trong đất và thường còn có thể bảo vệ rễ và các phần khác của cây khi tiếp xúc với đất của hạt phát triển từ hạt nảy mầm. Việc xử lý hạt có thể cũng có tác dụng bảo vệ lá bằng cách hoán chuyển hợp chất theo sáng chế hoặc hoạt chất thứ hai trong quá trình phát triển của cây. Phương pháp xử lý hạt có thể được dùng với tất cả các loại hạt, bao gồm hạt của thực vật được biến đổi gen để biểu hiện các tính trạng đặc biệt sẽ nảy mầm. Các ví dụ về các hạt này bao gồm các hạt biểu hiện độc tố protein đối với các giun tròn ký sinh, như độc tố *Bacillus thuringiensis* hoặc các hạt biểu hiện tính chống chịu thuốc diệt cỏ như glyphosat axetyltransferaza, mà nó tạo ra khả năng kháng glyphosat.

Một phương pháp xử lý hạt là phun hoặc rắc bụi lên hạt với hợp chất theo sáng chế (có nghĩa là dưới dạng hỗn hợp được chế hoá) trước khi gieo hạt. Chế phẩm được chế hoá để xử lý hạt thường chứa chất tạo màng hoặc chất bám dính. Do đó, thông thường chế phẩm bao hạt theo sáng chế chứa lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b, và chất tạo màng hoặc chất bám dính. Hạt có thể được bao bằng cách phun chất cô đặc huyền phù dễ chảy trực tiếp vào trống quay chứa hạt và sau đó sấy khô hạt. Theo cách khác, các loại chế phẩm khác như bột thấm ướt được, dung dịch, nhũ tương hỗn dịch, chất cô đặc nhũ hoá được và nhũ tương trong nước có

thể được phun lên hạt. Quy trình này đặc biệt hữu ích để tạo màng phủ lên hạt. Các máy bao phủ khác nhau và các quy trình có thể được chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này kiểm được dễ dàng. Các quy trình thích hợp bao gồm các quy trình được nêu trong ấn phẩm P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph số 57 và các tài liệu tham khảo được nêu trong đó.

Hạt đã xử lý thường chứa hợp chất theo sáng chế trong với lượng nằm trong khoảng từ 0,1g đến 1 kg cho 100 kg hạt (có nghĩa là nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% trọng lượng của hạt trước khi xử lý). Huyền phù dễ rót được chế hoá để xử lý hạt thường chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 70%, chất bám dính tạo màng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 30%, chất phân tán nằm trong khoảng từ 0,5 đến 20%, chất cô đặc nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, bột màu và/hoặc thuốc nhuộm nằm trong khoảng từ 0 đến 5%, chất chống tạo bọt nằm trong khoảng từ 0 đến 2%, chất bảo quản nằm trong khoảng từ 0 đến 1% và chất pha loãng lỏng dễ bay hơi nằm trong khoảng từ 0 đến 75%.

Để ứng dụng trong nông nghiệp, tỷ lệ dùng để thu được mức phòng trừ hiệu quả (tức là “lượng hữu hiệu sinh học”) sẽ phụ thuộc vào các yếu tố như loài giun tròn cần phòng trừ, vòng đời của giun tròn, giai đoạn sống, kích thước của nó, vị trí, thời gian trong năm, vụ mùa hoặc động vật chủ, phương thức cho ăn, phương thức giao phối, độ ẩm xung quanh, nhiệt độ, và các yếu tố tương tự. Trong các trường hợp bình thường, tỷ lệ dùng nằm trong khoảng từ 0,01 đến 2 kg hoạt chất cho mỗi héc ta là đủ để phòng trừ giun tròn trong hệ sinh thái nông nghiệp, nhưng cũng có thể đủ với lượng ít bằng 0,0001 kg/hecta hoặc có thể cần đến lượng nhiều bằng 8 kg/héc ta. Đối với các ứng dụng phi nông nghiệp, tỷ lệ sử dụng hiệu quả sẽ nằm trong khoảng từ 1,0 đến 50 mg/m² nhưng cũng có thể đủ với lượng ít bằng 0,1 mg/m² hoặc có thể cần đến lượng nhiều bằng 150 mg/m². Chuyên gia trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể dễ dàng xác định lượng hữu hiệu sinh học cần thiết để thu được mức phòng trừ giun tròn ký sinh mong muốn.

Ví dụ sinh học của sáng chế

Các thử nghiệm sau chứng minh hiệu quả phòng trừ của hợp chất theo sáng chế đối với loài gây hại cụ thể. “Hiệu quả phòng trừ” là khả năng ức chế sự phát triển của giun tròn ký sinh (kể cả làm chết) dẫn đến việc giảm ăn một cách đáng kể. Tuy

nhien, việc bảo vệ phòng trừ loài gây hại tạo ra bởi các hợp chất này không bị hạn chế ở các loài này.

Thử nghiệm A

Mức phòng trừ giun tròn gây sần rễ phương nam (*Meloidogyne incognita*) qua kiểu tác động tiếp xúc và/hoặc nội hấp, nghĩa là được đánh giá trong các bộ thử nghiệm gồm các đồ chứa không đầy, nhỏ được nạp đầy hỗn hợp đất pha cát và các cây giống con dưa chuột.

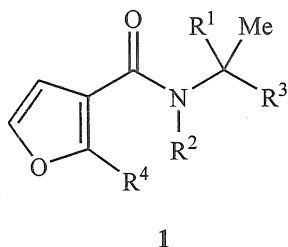
Các hợp chất thử nghiệm được pha chế trong dung dịch gồm 50% axeton và 50% nước. Hợp chất thử nghiệm được đưa trực tiếp vào đất của các bộ thử nghiệm ở nồng độ hoạt chất 250 hoặc 50 ppm. Mỗi thử nghiệm được thực hiện lặp lại 3 lần. Sau khi xử lý, các bộ thử nghiệm được để khô trong 1 giờ, sau đó khoảng 250 ấu trùng non giai đoạn thứ hai (J2) được đưa vào trong đất. Các bộ thử nghiệm được giữ ở 27°C và được tưới nước khi cần trong 7 ngày.

Hiệu quả trừ giun tròn được xác định bằng lượng nốt sần tạo thành quan sát được khi so sánh với mẫu không được xử lý. Sự tạo thành nốt sần không quan sát thấy ở mẫu giun tròn được phòng trừ 100%. Mức tạo thành nốt sần tương đương với mức được phát hiện trong mẫu kiểm chứng không được xử lý được chỉ ra là 0%. Mức phòng trừ giun tròn không được đưa ra với hợp chất có độc tố thực vật đáng kể.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở nồng độ 500 ppm, các hợp chất sau bộc lộ tác dụng bảo vệ thực vật tốt (mức phá hại rễ giảm 50% hoặc lớn hơn so với các mẫu kiểm chứng được xử lý bằng dung môi) và không có độc tố thực vật đáng kể: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 14, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 40, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 50, 52, 53, 56, 58, 60, 62, 63, 65, 67, 70, 72, 74, 75, 77, 80, 89, 90, 92, 95, 96, 101 và 103.

Yêu cầu bảo hộ

1. Hợp chất được chọn từ Công thức 1,



trong đó:

R^1 là H hoặc metyl;

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

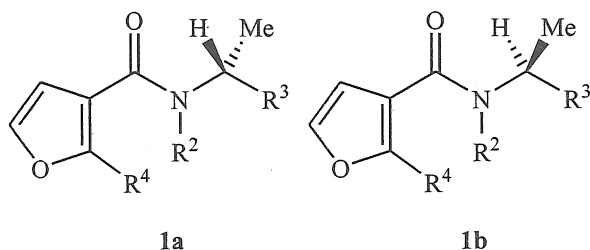
R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

với điều kiện là (i) khi R^1 là H, thì R^3 không phải là C_2-C_3 alkyl không được thế, hoặc C_2-C_3 alkyl được thế bằng Cl hoặc Br; và

(ii) khi R^1 là methyl, thì R^3 không phải là etyl.

2. Hợp chất được chọn từ Công thức 1a hoặc Công thức 1b,



trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

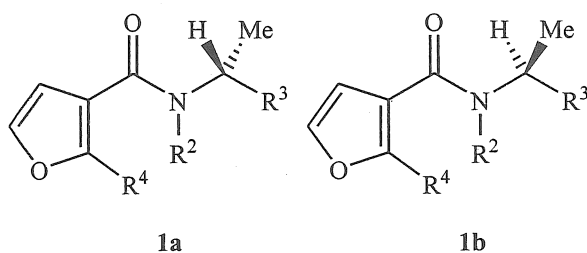
R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

3. Chế phẩm chứa (i) hợp chất có Công thức 1a hoặc Công thức 1b,



trong đó, tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 55:45; và

trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

(ii) ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng.

4. Chế phẩm theo điểm 3, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 65:35, tốt hơn là ít nhất là 75:25, tốt hơn nữa là ít nhất là 85:15, và thậm chí tốt hơn nữa là ít nhất 95:5.

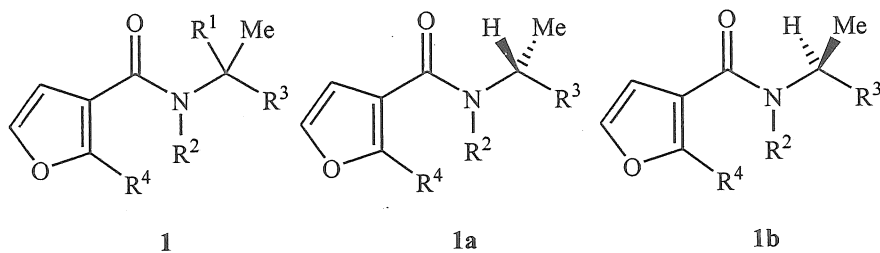
5. Chế phẩm theo điểm 4, trong đó tỷ lệ của 1b với 1a ít nhất là 97:3, tốt hơn là ít nhất là 99:1, tốt hơn nữa là gần như là 100:0.

6. Chế phẩm chứa hợp chất theo điểm 1 hoặc điểm 2, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axephat, axequinoxyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazat, bistrifluron, borat, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, cloantraniliprol, clofenapyr, clofluazuron, clopyrifos, clopyrifos-metyl, chromafenozit, clofentezin, clothianidin, xyantraniliprol, xyclaniliprol, xycloprothrin, xycloxaprid, xyflumetofen, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, 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, flonicamid, flubendiamit, fluxythrinate, flufenrim, flufenoxuron, flufenoxystrobin, fluensulfon, fluopyram, flupyradifuron, fluvalinat, tau-fluvalinat, fonophos, formetanat, fosthiazat, halofenozit, heptafluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizon, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiocarb, metomyl, metopren, metoxyclo, metoxyfenozit, metofluthrin, monocrotophos, monoflothrins, nicotine, nitenpyram, nithiazin, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumide, pymetrozin, pyrafluprol, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin,

pyriprol, pyriproxyfen, rotenon, ryanodin, silafluofen, spintoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozit, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetraclovinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tioxazafen, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamat, triclofon, triflumezopyrim, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, vi khuẩn gây chết cho côn trùng, virus gây chết cho côn trùng và nấm gây chết cho côn trùng.

7. Chế phẩm theo điểm 6, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, cloantraniliprol, clofenapyr, clocyprifos, clothianidin, xyantraniliprol, xyclaniliprol, xycloprothrin, xyfluthrin, beta-xyfluthrin, xyhalothrin, gamma-xyhalothrin, lambda-xyhalothrin, xypermethrin, alpha-xypermethrin, zeta-xypermethrin, xyromazin, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, ethiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerat, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, fluensulfon, flupiprol, flupyradifuron, fluvalinat, formetanat, fosthiazat, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizon, methiocarb, metomyl, metopren, metoxyfenozit, metofluthrin, monoflothin, nitenpyram, nithiazin, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozin, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodin, spintoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozit, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiametoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamat, triflumezopyrim, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* *Bacillus thuringiensis* nội độc tố delta, toàn bộ chủng của *Bacillus thuringiensis* và toàn bộ chủng của virus *Nucleo polyhydrosis*.

8. Phương pháp để phòng trừ giun tròn trú ngụ trong đất, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc giun tròn hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất được chọn từ Công thức 1, 1a hoặc 1b,



trong đó:

R^2 là H;

R^3 là $-CR^{6a}R^{6b}R^{6c}$;

R^4 là Cl hoặc Br;

R^{6a} là H, C_1-C_3 alkyl, C_2-C_3 alkenyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl;

R^{6b} là C_1-C_3 alkyl;

R^{6c} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc $-CR^{7a}R^{7b}R^{7c}$;

R^{7a} là H, halogen, xyano, C_1-C_3 alkoxy, C_1-C_3 alkylthio, C_1-C_3 alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl hoặc C_1-C_2 alkyl;

R^{7b} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl; và

R^{7c} là H, halogen, xyano hoặc C_1-C_2 alkyl.

9. Phương pháp theo điểm 8, trong đó môi trường là hạt.

10. Phương pháp theo điểm 8, trong đó hạt được bao bằng hợp chất có Công thức 1, 1a hoặc 1b được bào chế dưới dạng chế phẩm chứa chất tạo màng hoặc tác nhân kết dính.

11. Phương pháp để phòng trừ giun tròn trú ngụ trong đất, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc giun tròn hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học chế phẩm theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 3 đến 7.

12. Phương pháp theo điểm 8, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc giun tròn hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất có Công thức 1b.

13. Hạt đã được xử lý chứa hợp chất theo điểm 1 hoặc điểm 2, với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% trọng lượng của hạt trước khi được xử lý.