



(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)



1-0042380

(51)^{2020.01} C07D 471/04; A01N 43/90

(13) B

(21) 1-2021-00356

(22) 19/06/2019

(86) PCT/EP2019/066187 19/06/2019

(87) WO 2020/002082 02/01/2020

(30) 18179885.1 26/06/2018 EP

(45) 27/01/2025 442

(43) 25/03/2021 396

(73) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany

(72) WILLOT, Matthieu (FR); FISCHER, Rüdiger (DE); HAGER, Dominik (DE);

HOFFMEISTER, Laura (DE); WILCKE, David (DE); ILG, Kerstin (DE);

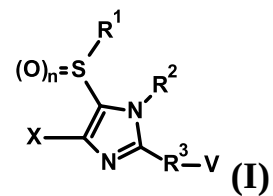
GÖRGES, Ulrich (DE).

(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG, CHẾ PHẨM HÓA NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY, VÀ
PHƯƠNG PHÁP PHI ĐIỀU TRỊ ĐỂ PHÒNG TRỪ ĐỘNG VẬT GÂY HẠI

(21) 1-2021-00356

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



trong đó X, R¹, R², R³, V và n có nghĩa được xác định như trong phần mô tả,

các chế phẩm hóa nông chứa các hợp chất này và các phương pháp và các hợp chất trung gian để điều chế chúng. Các hợp chất theo sáng chế là hữu dụng để làm chất diệt ve bét và/hoặc chất diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến các dẫn xuất dị vòng có công thức (I), việc sử dụng chúng làm chất diệt ve bét và/hoặc chất diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại, cụ thể là động vật chân khớp và đặc biệt là côn trùng và động vật thuộc lớp nhện, và các phương pháp và hợp chất trung gian để điều chế các dẫn xuất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các dẫn xuất dị vòng có các đặc tính diệt côn trùng đã được mô tả trong tài liệu chuyên ngành, ví dụ trong tài liệu WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/180193, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, WO 2016/124563, WO 2016/124557, WO 2015/121136, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2016/039441, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/039444, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286, WO 2016/046071, WO 2016/058928, WO 2016/059145, WO 2016/071214, WO 2016/091731, WO 2016/096584, WO 2016/107742, WO 2016/107831, WO 2016/113155, WO 2016/116338, WO 2016/121997, WO 2016/125621, WO 2016/125622, WO 2016/129684, WO 2016/142326, WO 2016/142327, WO 2016/169882, WO 2016/169886, WO 2018/130437 và WO 2018/130443.

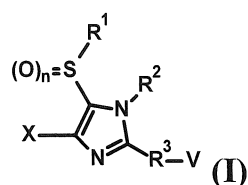
Các chế phẩm bảo vệ cây trồng hiện đại cần phải đáp ứng nhiều yêu cầu, ví dụ, liên quan đến phạm vi, độ tồn dư và phổ tác dụng và mục đích sử dụng có thể của chúng. Các vấn đề về độc tính, bảo tồn các loài có lợi và thực vật thụ phấn, các đặc tính môi trường, tỷ lệ áp dụng, khả năng tương thích với các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

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

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

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

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



trong đó (cấu hình 1-1)

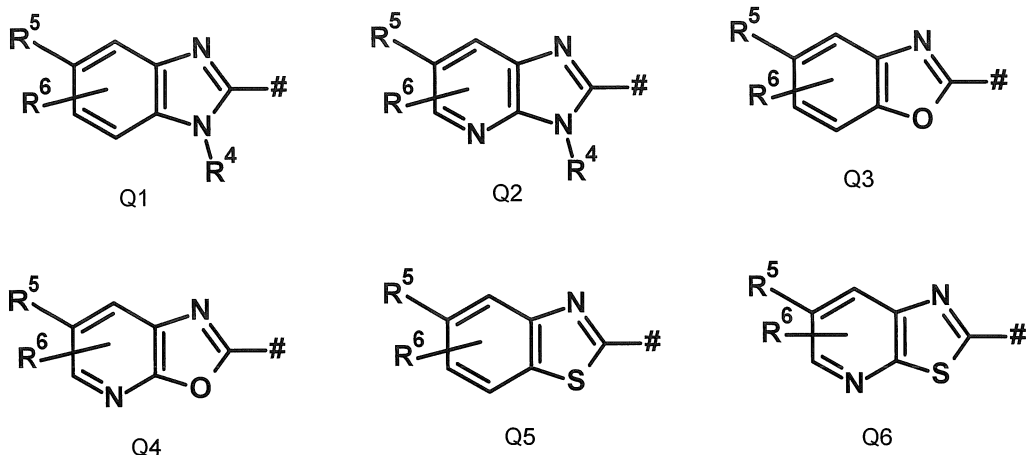
R^1 là $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{xyanoalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{hydroxyalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkoxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkenyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkenyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkynyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkynyl}$ hoặc $(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$,

R^2 là hydro, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{xyanoalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{hydroxyalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkoxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkoxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkenyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkenyloxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkenyloxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkenyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{xyanoalkenyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkynyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{alkynyloxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkynyloxy-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{haloalkynyl}$, $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{xyanoalkynyl}$, $(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$, $(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl-}(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl-}(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$, halo $(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$, xyano $(\text{C}_3\text{-C}_8)\text{cycloalkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkylthio-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkylthio-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkylsulfinyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkylsulfinyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkylsulfonyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkylsulfonyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkylcarbonyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{haloalkylcarbonyl-}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{alkyl}$,

C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl hoặc (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl,

R³ là aryl mà tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau hoặc là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại, mà trong mỗi trường hợp có thể chứa ít nhất một nhóm carbonyl và/hoặc trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp có thể như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)-alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino,

- V là (C₃-C₆)xycloalkyl hoặc aryl mà trong mỗi trường hợp tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau hoặc là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc nhiều lần bởi các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại, mà trong mỗi trường hợp có thể chứa ít nhất một nhóm carbonyl và/hoặc trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp có thể như sau: xyano, carboxyl, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alkylsilyl, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl, (C₁-C₆)xyanoalkyl, (C₁-C₆)hydroxyalkyl, hydroxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkyl, (C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)haloalkenyl, (C₂-C₆)xyanoalkenyl, (C₂-C₆)alkynyl, (C₂-C₆)haloalkynyl, (C₂-C₆)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)haloalkoxy, (C₁-C₆)xyanoalkoxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkoxy, (C₁-C₆)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)haloalkyl-(C₁-C₆)alkoxyimino, (C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)haloalkylthio, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylthio, (C₁-C₆)alkylthio-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfinyl, (C₁-C₆)alkylsulfinyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkoxy-(C₁-C₆)alkylsulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyl-(C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₆)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₆)alkylcarbonyl, (C₁-C₆)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkyl-aminocarbonyl, (C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, di-(C₂-C₆)alkenylaminocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)alkylsulfonylamino, (C₁-C₆)alkylamino, di-(C₁-C₆)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₆)alkylsulfoximino, aminothiocarbonyl, (C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)alkylaminothiocarbonyl, (C₃-C₈)xycloalkylamino, (C₁-C₆)alkylcarbonylamino,
- X là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh từ các nhóm Q1 đến Q6,



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

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

n là 0, 1 hoặc 2.

Ngoài ra, cũng đã phát hiện ra rằng, các hợp chất có công thức (I) có hiệu lực rất tốt làm chất diệt sinh vật gây hại, tốt hơn là chất diệt côn trùng và/hoặc chất diệt ve bét, và tổng quát hơn nữa, chúng còn có độ tương thích rất tốt với thực vật, cụ thể là với cây trồng.

Các hợp chất theo sáng chế được xác định chung bằng công thức (I). Các phần tử thể được ưu tiên hoặc phạm vi các gốc xác định trong các công thức ở trên và dưới đây được minh họa sau đây:

Cấu hình 2-1

- R¹ tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- R² tốt hơn là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl,
- R³ tốt hơn là aryl mà tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau hoặc là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại từ nhóm gồm N, O và S, mà trong mỗi trường hợp có thể chứa ít nhất một nhóm carbonyl và/hoặc trong đó các phần tử thể trong mỗi trường hợp có thể như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₄)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-

C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino,

- V tốt hơn là (C₃-C₆)xycloalkyl hoặc aryl mà trong mỗi trường hợp tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau hoặc là vòng no, no một phần hoặc vòng dị vòng thơm mà tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau, trong đó ít nhất một nguyên tử cacbon được thay thế bằng nguyên tử khác loại từ nhóm gồm N, O và S, mà trong mỗi trường hợp có thể chứa ít nhất một nhóm carbonyl và/hoặc trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp có thể như sau: xyano, halogen, nitro, axetyl, amino, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)hydroxyalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)xyanoalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₂-C₄)xyanoalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)xyanoalkoxy, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, -N=C(H)-O(C₁-C₄)alkyl, -C(H)=N-O(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylthio-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfinyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylamino, di(C₁-C₄)alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, di(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl, (C₁-C₄)alkylcarbonylamino,
- X tốt hơn là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh từ các nhóm Q1 đến Q6,
- R⁴ tốt hơn là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₁-C₄)xyanoalkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-

C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R⁵, R⁶ độc lập với nhau tốt hơn là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano(C₃-C₆)xycloalkyl, halo(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,

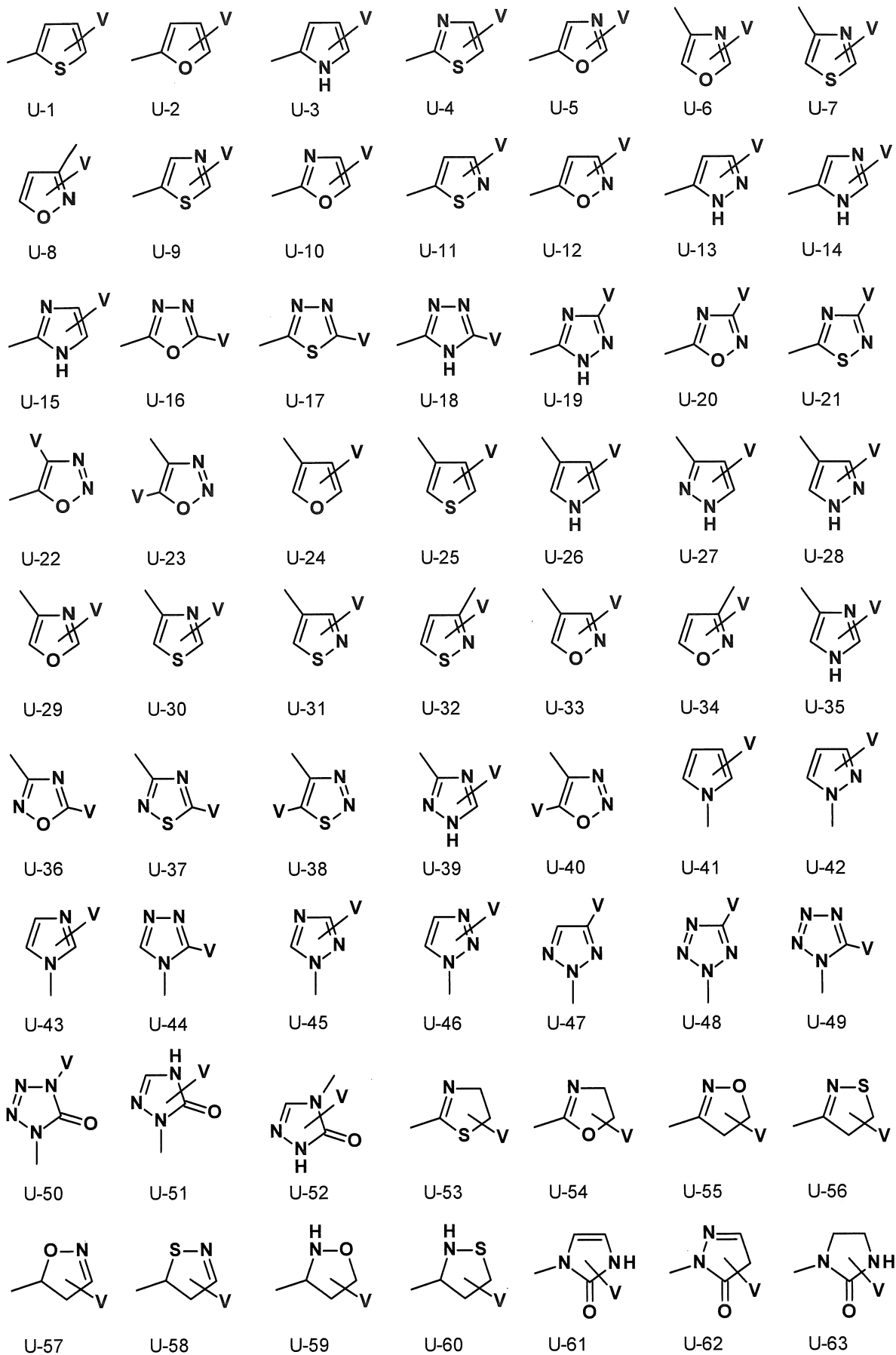
n tốt hơn là 0, 1 hoặc 2.

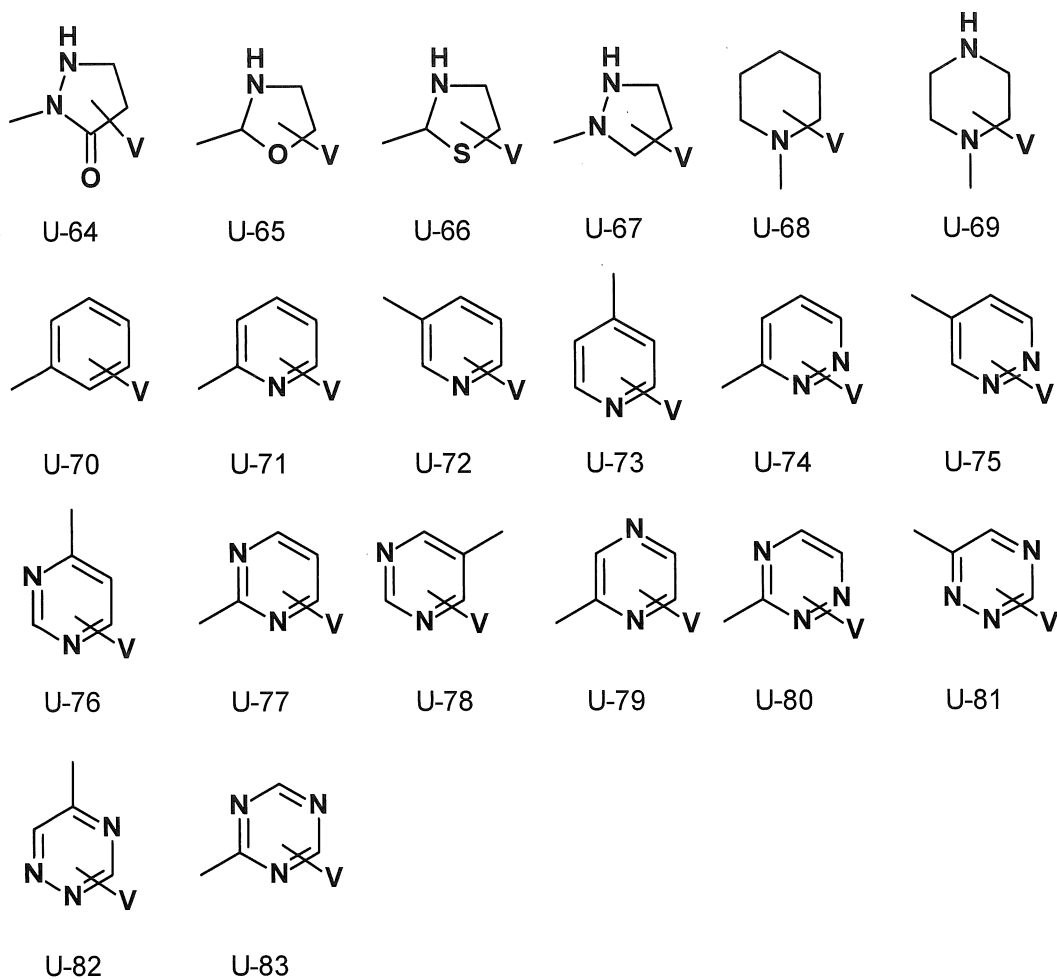
Cấu hình 3-1

R¹ đặc biệt tốt hơn là (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,

R² đặc biệt tốt hơn là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₃-C₆)xycloalkyl hoặc halo(C₃-C₆)xycloalkyl,

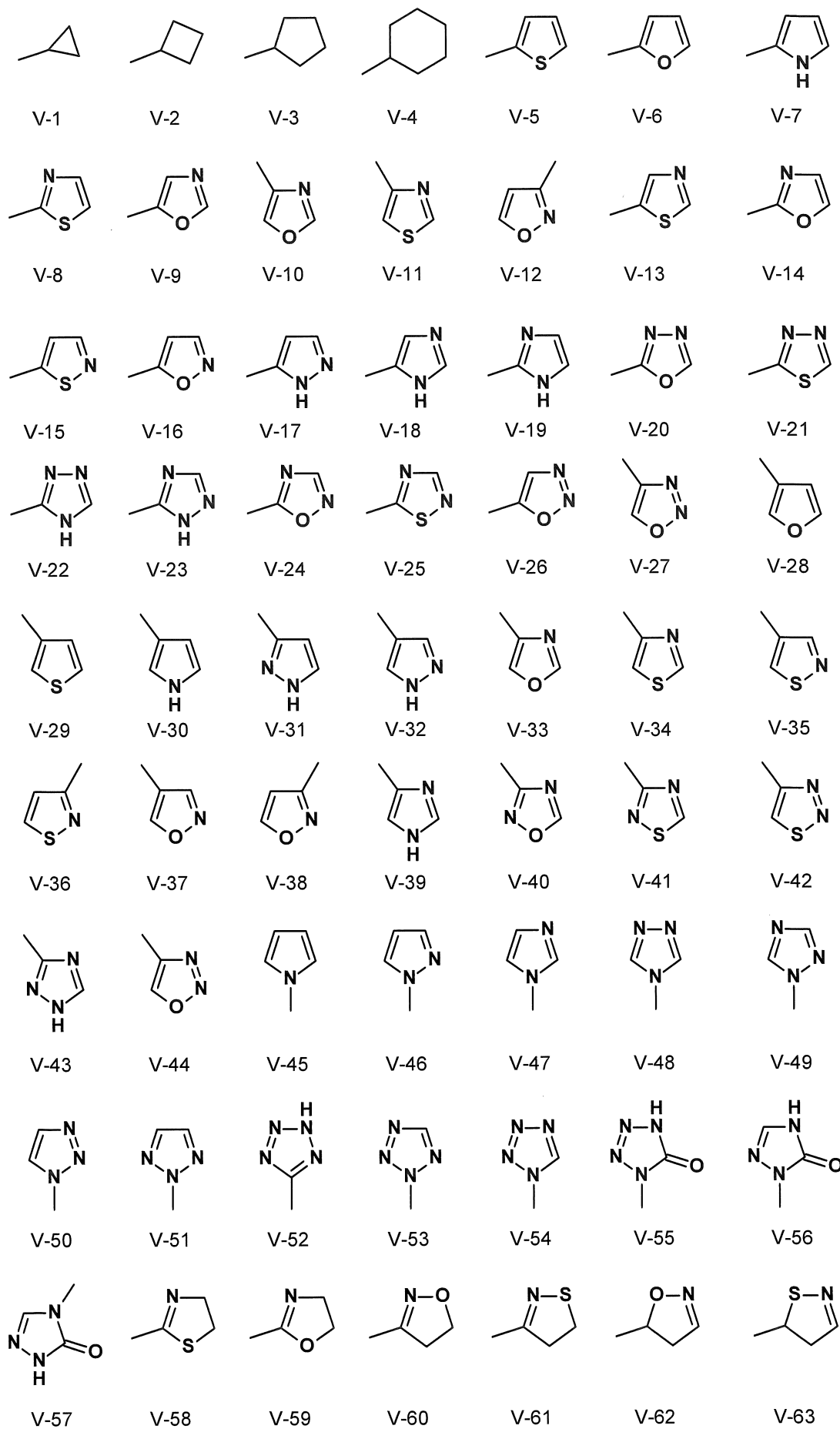
R³-V đặc biệt tốt hơn là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm U-1 đến U-83, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,

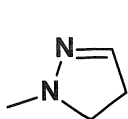




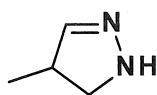
trong đó

- V đặc biệt tốt hơn là vòng có 3 đến 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm V-1 đến V-105, trong đó các phần tử thế có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy,

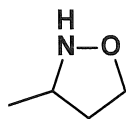




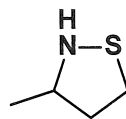
V-64



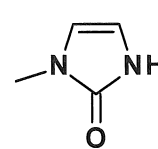
V-65



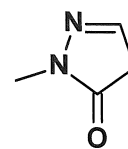
V-66



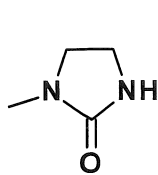
V-67



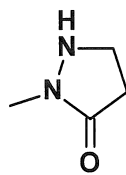
V-68



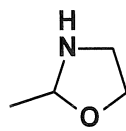
V-69



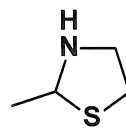
V-70



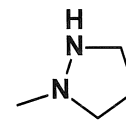
V-71



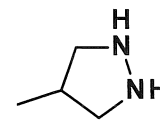
V-72



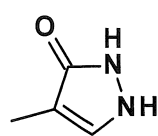
V-73



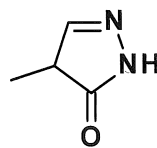
V-74



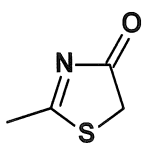
V-75



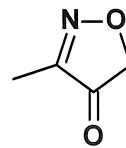
V-76



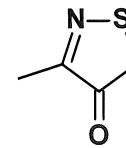
V-77



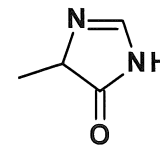
V-78



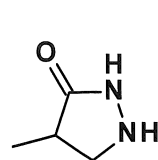
V-79



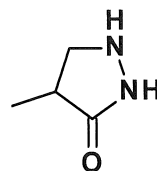
V-80



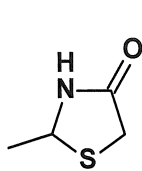
V-81



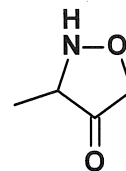
V-82



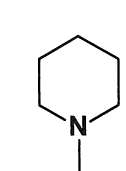
V-83



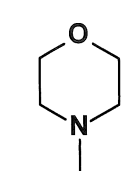
V-84



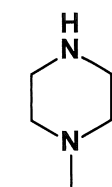
V-85



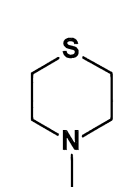
V-86



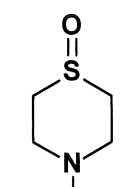
V-87



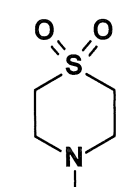
V-88



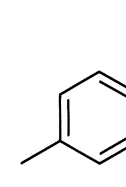
V-89



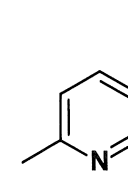
V-90



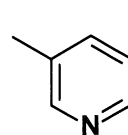
V-91



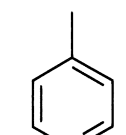
V-92



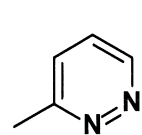
V-93



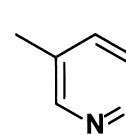
V-94



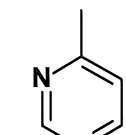
V-95



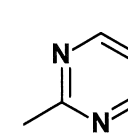
V-96



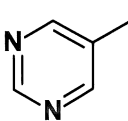
V-97



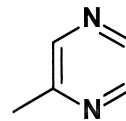
V-98



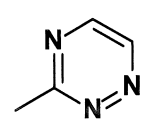
V-99



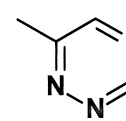
V-100



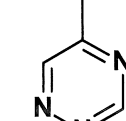
V-101



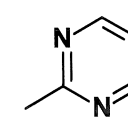
V-102



V-103



V-104



V-105

X đặc biệt tốt hơn là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh từ các nhóm

Q1, Q2 và Q3,

- R⁴ đặc biệt tốt hơn là hydro, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- R⁵ đặc biệt tốt hơn là halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl, (C₂-C₄)alkenyl, (C₂-C₄)haloalkenyl, (C₂-C₄)alkynyl, (C₂-C₄)haloalkynyl, (C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)haloalkyl-(C₃-C₆)xycloalkyl, xyano-(C₃-C₆)xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)xycloalkyl, (C₁-C₄)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)haloalkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyloxy, (C₁-C₄)alkylcarbonyl hoặc (C₁-C₄)haloalkylcarbonyl,
- R⁶ đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)haloalkyl hoặc (C₃-C₆)xycloalkyl,
- n đặc biệt tốt hơn là 0, 1 hoặc 2.

Theo phương án đặc biệt ưu tiên, R³ tùy ý có thể được thế một lần hoặc hai lần, ngoài với V, bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được lựa chọn từ xyano, halogen, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy hoặc (C₁-C₄)haloalkoxy.

Cấu hình 4-1

- R¹ thậm chí đặc biệt tốt hơn là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,
- R² thậm chí đặc biệt tốt hơn là hydro, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,
- R³-V thậm chí đặc biệt tốt hơn là vòng tùy ý được thế một lần có 5 hoặc 6 cạnh từ các nhóm U-1, U-2, U-3, U-4, U-5, U-6, U-7, U-8, U-9, U-10, U-11, U-12, U-13, U-14, U-15, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-30, U-31, U-32, U-33, U-34, U-35, U-41, U-42, U-43, U-44, U-45, U-46, U-47, U-51, U-52, U-53, U-54, U-

55, U-56, U-57, U-58, U-61, U-62, U-68, U-69, U-70, U-71, U-72, U-73, U-74, U-75, U-76, U-77, U-78 hoặc U-79, trong đó các phần tử thể có thể trong mỗi trường hợp là: xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy hoặc triflometoxy,

trong đó

- V thậm chí đặc biệt tốt hơn là vòng có 3 đến 6 cạnh, tùy ý được thể một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ nhóm gồm xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy và triflometoxy, được lựa chọn từ V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-6, V-7, V-8, V-9, V-10, V-11, V-12, V-13, V-14, V-15, V-16, V-17, V-18, V-19, V-28, V-29, V-30, V-31, V-32, V-33, V-34, V-35, V-36, V-37, V-38, V-39, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-58, V-59, V-62, V-63, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 hoặc V-101,
- X thậm chí đặc biệt tốt hơn là hệ vòng dị vòng thơm từ các nhóm Q2 và Q3,
- R⁴ thậm chí đặc biệt tốt hơn là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,
- R⁵ thậm chí đặc biệt tốt hơn là flo, clo, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl, pentafoetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfonyl hoặc triflometylsulfinyl,
- R⁶ thậm chí đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, metyl, triflometyl, flo hoặc clo,
- n thậm chí đặc biệt tốt hơn là 0, 1 hoặc 2.

Theo phương án rất đặc biệt được ưu tiên, R³ có thể tùy ý được thể một lần, ngoài với V, bằng xyano, flo, clo, brom, metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, metoxy hoặc triflometoxy.

Cấu hình 5-1

- R¹ tốt nhất là etyl,
- R² tốt nhất là metyl,
- R³-V tốt nhất là vòng, tùy ý được thể một lần bằng brom, từ các nhóm U-1, U-13, U-28, U-42, U-57 và U-70,

trong đó

- V tốt nhất là vòng, tùy ý được thế một lần bằng xyano hoặc clo, từ các nhóm V-1, V-92, V-93 và V-94,
- X tốt nhất là hệ vòng dị vòng thơm từ nhóm Q2,
- R⁴ tốt nhất là metyl,
- R⁵ tốt nhất là triflometyl hoặc pentafluoretyl,
- R⁶ tốt nhất là hydro,
- n tốt nhất là 2.

Theo phương án được ưu tiên 5-2, R³ có thể tùy ý được thế một lần, ngoài với V, bằng brom.

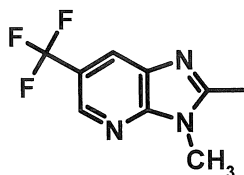
Cấu hình 5-2

- R¹ tốt nhất là etyl,
 - R² tốt nhất là metyl,
 - R³-V tốt nhất là vòng, tùy ý được thế một lần bằng xyano hoặc brom, từ các nhóm U-1, U-13, U-28, U-41, U-42, U-57, U-70, U-71 và U-72,
- trong đó
- V tốt nhất là vòng, tùy ý được thế một lần bằng xyano, flo hoặc clo, từ các nhóm V-1, V-5, V-87, V-92, V-93 và V-94,
 - X tốt nhất là hệ vòng dị vòng thơm từ nhóm Q2,
 - R⁴ tốt nhất là metyl,
 - R⁵ tốt nhất là triflometyl hoặc pentafluoretyl,
 - R⁶ tốt nhất là hydro,
 - n tốt nhất là 2.

Theo phương án được ưu tiên 5-2, R³ có thể tùy ý được thế một lần, ngoài với V, bằng xyano hoặc brom.

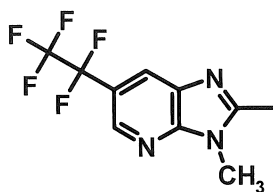
Việc thế ở các vòng từ U-1 đến U-83 và tương tự, từ V-1 đến V-105 có thể bằng sự thế hydro tại nguyên tử cacbon và/hoặc tại nguyên tử nito.

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là



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

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là



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

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q1 và R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, V và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q2 và R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, V và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q3 và R¹, R², R³, R⁵, R⁶, V và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I)

trong đó X là Q4 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, V$ và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q5 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, V$ và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Theo phương án được ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó X là Q6 và $R^1, R^2, R^3, R^5, R^6, V$ và n có các nghĩa được xác định trong cấu hình (2-1) hoặc cấu hình (3-1) hoặc cấu hình (4-1) hoặc cấu hình (5-1) hoặc cấu hình (5-2).

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo các định nghĩa chung hoặc được ưu tiên, trừ khi được quy định theo cách khác, halogen được lựa chọn từ nhóm gồm flo, clo, brom và iot, tốt hơn từ nhóm gồm flo, clo và brom.

Aryl (bao gồm cả dưới dạng một phần của đơn vị lớn hơn, ví dụ, arylalkyl), trừ khi được xác định theo cách khác ở phần khác, được chọn từ nhóm phenyl, naphthyl, anthryl, phenanthrenyl, và tốt hơn là phenyl.

Trong ngữ cảnh của sáng chế, trừ khi được xác định theo cách khác ở phần khác, thuật ngữ "alkyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ, haloalkyl, được hiểu với nghĩa là gốc của nhóm hydrocacbon béo no có 1 đến 12 nguyên tử cacbon và có thể phân nhánh hoặc không phân nhánh. Ví dụ về các gốc C_1 - C_{12} -alkyl là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodexyl. Trong số các gốc alkyl này, đặc biệt được ưu tiên là các gốc C_1 - C_6 -alkyl. Đặc biệt được ưu tiên là các gốc C_1 - C_4 -alkyl.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định theo cách khác ở phần khác, thuật ngữ "alkenyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu với nghĩa là gốc C_2 - C_{12} -alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-

hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C_2 - C_6 -alkenyl và đặc biệt ưu tiên là các gốc C_2 - C_4 -alkenyl.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định theo cách khác ở phần khác, thuật ngữ "alkynyl", đơn lẻ hoặc kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu với nghĩa là gốc C_2 - C_{12} -alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -alkynyl và đặc biệt ưu tiên là các gốc C_3 - C_4 -alkynyl. Gốc alkynyl cũng có thể chứa ít nhất một liên kết đôi.

Theo sáng chế, trừ khi được xác định theo cách khác ở bất kỳ phần nào khác, thuật ngữ "xycloalkyl", bản thân nó hoặc theo cách khác, kết hợp với các thuật ngữ khác, được hiểu có nghĩa là gốc C_3 - C_8 -xycloalkyl, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C_3 - C_6 -xycloalkyl.

Thuật ngữ "alkoxy", bản thân nó hoặc theo cách khác, kết hợp với các thuật ngữ khác, ví dụ haloalkoxy, được hiểu trong trường hợp này có nghĩa là gốc O-alkyl, trong đó thuật ngữ "alkyl" là như được xác định ở trên.

Các gốc được thế halogen, ví dụ haloalkyl, là được halogen hóa một lần hoặc nhiều lần, tới số lượng tối đa các phần tử thế có thể. Trong trường hợp halogen hóa nhiều lần, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau. Trong trường hợp này, halogen là flo, clo, brom hoặc iot, tốt hơn là flo, clo hoặc brom.

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

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

Theo sáng chế, được ưu tiên là sử dụng các hợp chất có công thức (I) bao gồm tổ hợp các nghĩa được liệt kê ở trên theo phương án được ưu tiên.

Theo sáng chế, đặc biệt được ưu tiên là sử dụng các hợp chất có công thức (I) bao gồm tổ hợp các nghĩa được liệt kê ở trên theo phương án đặc biệt được ưu tiên.

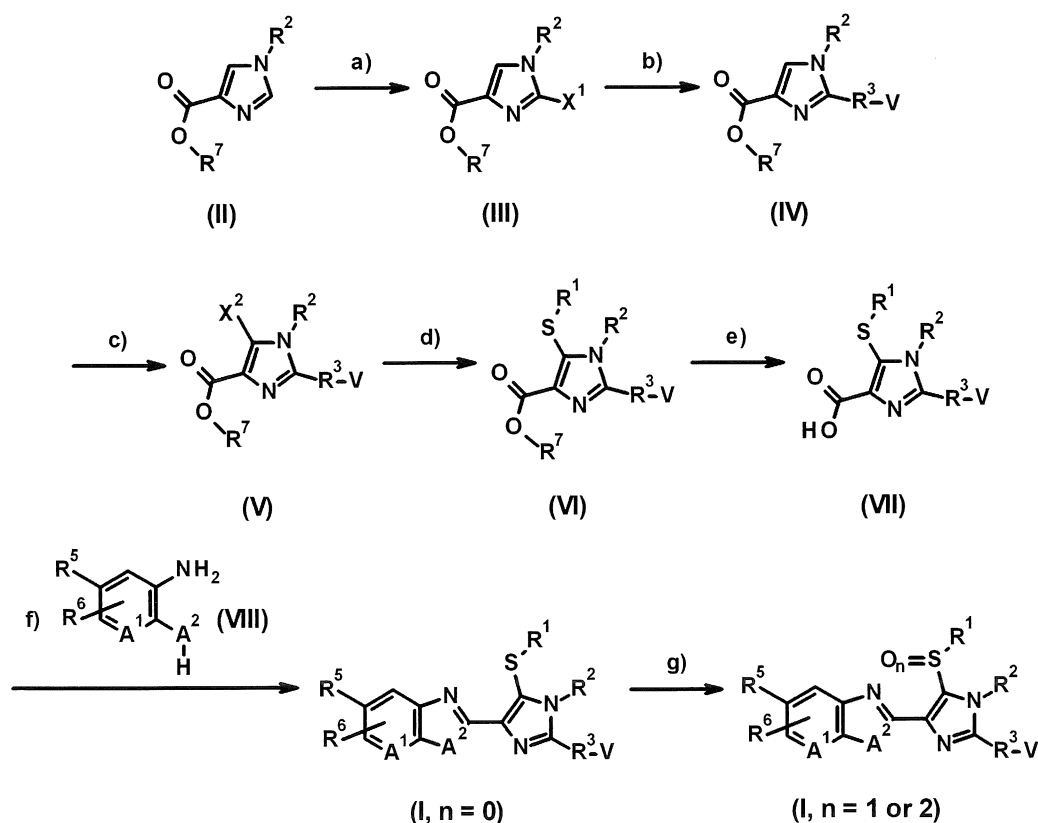
Theo sáng chế, rất đặc biệt được ưu tiên là sử dụng các hợp chất có công thức (I) bao gồm tổ hợp các định nghĩa được liệt kê ở trên theo phương án rất đặc biệt được ưu tiên.

Sáng chế nhấn mạnh việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) bao gồm tổ hợp các nghĩa được liệt kê ở trên theo phương án được nhấn mạnh.

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

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

Quy trình A



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và V có nghĩa như được mô tả ở trên. A^1 là N hoặc CH và A^2 là -N- R^4 , O hoặc S, trong đó R^4 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 và X^2 là halogen. R^7 là (C₁-C₄)-alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được điều chế từ các dẫn xuất imidazol có công thức (II), ví dụ bằng phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như *N*-bromosuxinimit (NBS) trong dung môi, ví dụ như tetrahydrofuran hoặc bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với NBS kết hợp với azobis(isobutyronitril) (AIBN) trong tetraclometan hoặc cloroform, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO 2013/149997, WO 2014/115077 hoặc WO 2011/123609.

Các dẫn xuất imidazol có công thức (II) có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO 2014/191894, US 2003/229079 hoặc WO 2013/156608.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (III), trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, có thể được chuyển đổi thành các hợp chất có công thức (IV), ví dụ bằng cách ghép cặp chéo qua trung gian kim loại chuyển tiếp [cf. *Chem.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**] hoặc bằng cách thế ái nhân thơm (tham khảo các quy trình được mô tả trong tài liệu *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2007**, 17, 5825-5830 hoặc US 4125726).

Ví dụ, các hợp chất có công thức (III), trong đó X^1 tốt hơn là clo hoặc brom, có thể được phản ứng với các axit boronic thích hợp [$V-R^3-B(OH)_2$] hoặc các este boronic theo các phương pháp đã biết (tham khảo tài liệu WO 2012/143599, US 2014/094474, US 2014/243316, US 2015/284358 hoặc *Journal of Organic Chemistry* **2004**, 69, 8829-8835) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm các muối kim loại chuyển tiếp để thu được các hợp chất có công thức (IV). Ví dụ về các chất xúc tác ghép đôi được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II), bis(triphenylphosphin)paladi(II) diclorua hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất phụ trợ phản ứng kiềm thích

hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình tốt hơn là các cacbonat của natri, kali hoặc xesi. Một số dẫn xuất axit boronic cần thiết $[V-R^3-B(OH)_2]$ hoặc dẫn xuất este boronic là đã biết và/hoặc có sẵn trên thị trường, hoặc các dẫn xuất này có thể được điều chế bằng các phương pháp chung đã biết (tham khảo tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011). Trong trường hợp này, phản ứng tốt hơn được tiến hành thực hiện trong hỗn hợp của nước và dung môi hữu cơ được lựa chọn từ các dung môi thông thường mà các dung môi này là trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ete như tetrahydrofuran, dioxan hoặc 1,2-dimetoxyetan thường được sử dụng.

Theo cách khác, có thể sử dụng các dẫn xuất stan $[V-R^3-Sn(n-Bu)_3]$ làm đối tác ghép đôi (tham khảo tài liệu US 2013/281433, WO 2004/099177 hoặc WO 2016/071214). Một số dẫn xuất stan $[V-R^3-Sn(n-Bu)_3]$ cần thiết là đã biết và/hoặc có sẵn trên thị trường, hoặc các dẫn xuất này có thể được điều chế bằng các phương pháp thông thường đã biết (tham khảo tài liệu WO 2016/071214 hoặc WO 2007/148093).

Việc ghép đôi các dẫn xuất imidazol được halogen hóa có công thức (III) với các dị vòng thơm chứa NH như imidazol hoặc pyrazol, tùy ý được thể như đã mô tả ở trên, để thu được các hợp chất có công thức (IV) có thể được thực hiện bằng phản ứng trong các điều kiện kiềm (ví dụ với natri hydrua trong dimetylformamit, ví dụ tham khảo tài liệu WO 2005/058898). Theo cách khác, phản ứng có thể được thực hiện trong môi trường khí trơ bằng cách xúc tác bằng các muối đồng(I), đồng(I) iodua ví dụ, với sự có mặt của phối tử thích hợp, ví dụ *trans*-*N,N*-dimetylxyclohexan-1,2-diamin hoặc *R*-(+)-prolin, và bazơ thích hợp sui, ví dụ kali cacbonat hoặc kali phosphat, trong dung môi thích hợp như 1,4-dioxan hoặc toluen (ví dụ tham khảo tài liệu WO 2016/109559).

Bước c)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (V), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm gồm brom hoặc iot, có thể được điều chế sử dụng các phương pháp tiêu chuẩn từ các hợp chất có công thức (IV) bằng phản ứng với, ví dụ, brom hoặc *N*-bromosuxinimit (NBS), (tham khảo tài liệu WO 2009/115572 hoặc WO 2010/091411) hoặc *N*-iodosuxinimit (NIS), tùy ý với sự có mặt của axit axetic hoặc axit trifloaxetic (tham khảo tài liệu WO 2008/063287, WO 2007/087548 hoặc WO 2009/152025).

Bước d)

Các hợp chất có công thức (V), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm gồm brom hoặc iot, có thể được chuyển đổi thành các hợp chất có công thức (VI), ví dụ bằng phản ứng trong các điều kiện kiềm với các dẫn xuất mercaptan (R^1-SH) và các muối đồng(I) (tham khảo tài liệu EP257918 hoặc WO 2009/152025) hoặc bằng phản ứng thế ái nhân thom (tham khảo tài liệu *Australian Journal of Chemistry* **1987**, 40, 1415-1425).

Theo cách khác, phản ứng của các hợp chất có công thức (V), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm gồm brom hoặc iot, với các dẫn xuất mercaptan (R^1-SH) có thể được thực hiện với sự có mặt của chất xúc tác paladi như tris(dibenzylidenaxeton)dipaladi [$Pd_2(dba)_3$]. Trong trường hợp này, được sử dụng thường xuyên là các bazơ amin như trietylamin hoặc *N,N*-diisopropyletylamin (DIPEA) và cả các phối tử phosphin như Xantphos (tham khảo tài liệu WO 2013/025958, WO 2013/066869, US 2009/027039, WO 2011/058149, WO 2011/143466 hoặc *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2016**, 26, 2984-2987). Trong trường hợp này, phản ứng tốt hơn được tiến hành trong dung môi được lựa chọn từ các dung môi thông thường mà các dung môi này là trơ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Tốt hơn là sử dụng ete, ví dụ, dioxan hoặc 1,2-dimetoxyetan.

Các dẫn xuất mercaptan, ví dụ metyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu US 2006/025633, US 2006/111591, US2820062, *Chemical Communications* **2000**, 13, 1163-1164 hoặc *Journal of the American Chemical Society* **1922**, 44, 1323-1333.

Bước e)

Các este có công thức (VI) có thể được chuyển đổi thành axit carboxylic có công thức (VII) sử dụng các phương pháp tiêu chuẩn (ví dụ, tham khảo tài liệu WO 2014/191894, US 2006/194779, WO 2014/086663 hoặc *European Journal of Organic Chemistry* **2009**, 213-222), ví dụ với hydroxit kim loại kiềm làm bazơ, như natri hydroxit hoặc lithi hydroxit, trong rượu làm dung môi, ví dụ metanol hoặc ethanol.

Bước f)

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

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

Quá trình chuyển đổi thành các hợp chất có công thức (I, $n = 0$) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, tốt hơn là thực hiện phản ứng trong dung môi được lựa chọn từ các dung môi thông thường mà chúng trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Tốt hơn là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; rượu như metanol, etanol hoặc isopropanol; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ *N,N*-dimetylformamit hoặc *N*-metylpyrrolidon, hoặc hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Ví dụ về tác nhân ngưng tụ thích hợp là carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; anhydrit như anhydrit axetic, anhydrit trifloaxetic; hỗn hợp của triphenylphosphin, bazơ và cacbon tetraclorea, hoặc hỗn hợp của triphenylphosphin và azo dieste, ví dụ axit diethylazodicarboxylic.

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

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

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

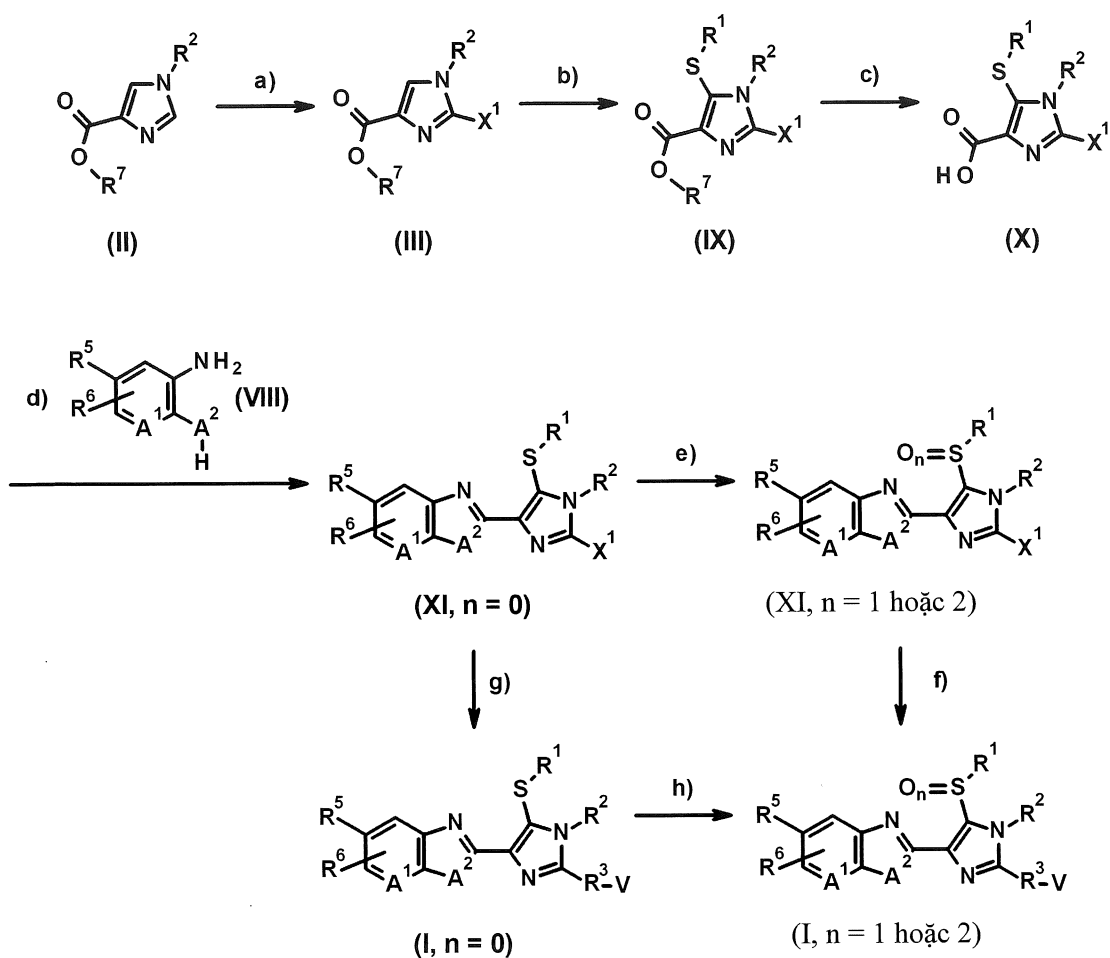
Ví dụ về bazơ thích hợp là dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-diazabixyclo[5.4.0]-7-undexen (DBU); amin bậc ba như trietylamin và *N,N*-diisopropyletylamin; bazơ vô cơ như kali phosphat, kali cacbonat và natri hydrua.

Bước g)

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

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

Quy trình B



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và V có nghĩa như được mô tả ở trên. A^1 là N hoặc CH và A^2 là -N- R^4 , O hoặc S, trong đó R^4 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 là halogen. R^7 là (C₁-C₄)-alkyl.

Bước a)

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

công thức (II), ví dụ bằng phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như *N*-bromosuxinimit (NBS) trong dung môi ví dụ như tetrahydrofuran hoặc bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với NBS kết hợp với azobis(isobutyronitril) (AIBN) trong cacbon tetraclorea hoặc cloroform, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO 2013/149997, WO 2014/115077 hoặc WO 2011/123609.

Các dẫn xuất imidazol có công thức (II) có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO 2014/191894, US 2003/229079 hoặc WO 2013/156608.

Bước b)

Các dẫn xuất imidazol có công thức (IX) có thể được điều chế sử dụng các phương pháp tiêu chuẩn từ các hợp chất có công thức (III) bằng phản ứng với disulfit ($R^1-S-S-R^1$) và ví dụ, bazơ mạnh, tốt hơn là lithi diisopropylamit (LDA) trong tetrahydrofuran (tham khảo tài liệu *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* **2010**, 20, 1084-1089) hoặc ví dụ, hydro peroxit và iot trong etanol (tham khảo tài liệu *Synthesis* **2015**, 47, 659-671).

Bước c)

Quá trình chuyển đổi các hợp chất có công thức (IX) thành các hợp chất có công thức (X) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước e).

Bước d)

Phản ứng của các hợp chất có công thức (X) với các hợp chất có công thức (VIII) để thu được các hợp chất có công thức (XI, $n = 0$) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước f).

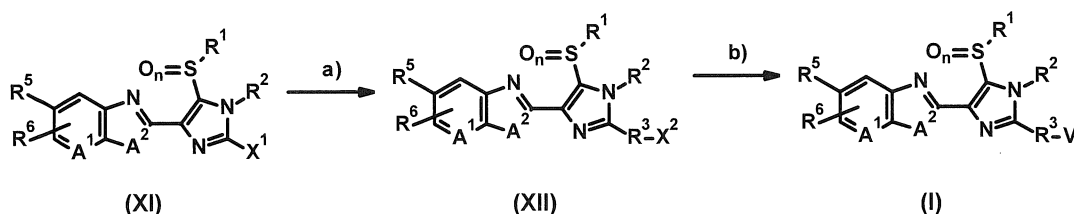
Bước e, h)

Quá trình chuyển đổi các hợp chất có công thức (XI, $n = 0$) thành các hợp chất có công thức (XI, $n = 1$ hoặc 2) và tương tự, quá trình chuyển đổi các hợp chất có công thức (I, $n = 0$) thành các hợp chất có công thức (I, $n = 1$ hoặc 2) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước g).

Bước f, g)

Quá trình chuyển đổi các hợp chất có công thức (XI, $n = 0$) thành các hợp chất có công thức (I, $n = 0$) và tương tự, quá trình chuyển đổi các hợp chất có công thức (XI, $n = 1$ hoặc 2) thành các hợp chất có công thức (I, $n = 1$ hoặc 2) được thực hiện tương tự như quy trình A, bước b).

Quy trình C



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và V có nghĩa như được mô tả ở trên. A^1 là N hoặc CH và A^2 là $-\text{N}-\text{R}^4$, O hoặc S, trong đó R^4 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 và X^2 là halogen. n là 0, 1 hoặc 2.

Bước a)

Quá trình điều chế các hợp chất có công thức (XII) trong đó $\text{R}^3\text{-X}^2$ là vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nitơ có thể diễn ra, ví dụ từ các hợp chất có công thức (XI) trong đó, X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu chuyên ngành (ví dụ, xem trong *Journal of Organic Chemistry* **2010**, 69, 5578-5587), ví dụ với sự có mặt của đồng(I) iodua và các chất phụ gia phản ứng kiềm, ví dụ *trans-N,N'*-dimetylcyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Tốt hơn là sử dụng toluen. Ngoài ra, phản ứng kết hợp có thể được thực hiện từ hợp chất có công thức (XI), trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm flo, clo hoặc brom, không có xúc tác kim loại với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, chẳng hạn các hydrocacbon béo hoặc thơm. Ưu tiên sử dụng axetonitril hoặc dimetylformamit.

Các hợp chất cần thiết có công thức $\text{H}-\text{R}^3\text{-X}^2$ là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết.

Các hợp chất có công thức (XII) trong đó, R^3-X^2 là vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua cacbon có thể được điều chế, ví dụ từ các hợp chất có công thức (XI), trong đó X^1 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, thông thường theo các phương pháp đã biết (tham khảo tài liệu *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

Ví dụ, các hợp chất có công thức (XI) trong đó X^1 tốt hơn là clo hoặc brom có thể được phản ứng với các axit arylboronic thích hợp hoặc các este của chúng bằng các phương pháp đã biết (tham khảo tài liệu WO 2010071819) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ nhóm các muối kim loại chuyển tiếp để thu được các hợp chất có công thức (XII). Ví dụ về các chất xúc tác kết hợp được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất phụ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình này tốt hơn là các cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết là đã biết và/hoặc có bán trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết thông thường (xem trong tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

Bước b)

Quá trình điều chế các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3-V là gốc hai vòng được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua nito có thể diễn ra, ví dụ từ các hợp chất có công thức (XII) trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp đã biết trong tài liệu chuyên ngành (ví dụ, xem trong tài liệu *Journal of Organic Chemistry* **2010**, 69, 5578-5587), ví dụ với sự có mặt của đồng(I) iodua và các chất phụ gia phản ứng kiềm, ví dụ *trans-N,N'*-dimetylxyclohexan-1,2-diamin và kali cacbonat, trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Tốt hơn là sử dụng toluen. Ngoài ra, phản ứng kết hợp có thể được thực hiện từ hợp chất có công thức (XII), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm flo, clo hoặc brom, không có xúc tác kim loại với sự có mặt của bazơ thích hợp, ví dụ như kali cacbonat hoặc xesi cacbonat trong dung môi hoặc chất pha loãng thích hợp. Dung môi hoặc chất

pha loãng hữu dụng bao gồm tất cả các dung môi hữu cơ trơ, ví dụ các hydrocacbon béo hoặc thơm. Tốt hơn là sử dụng axetonitril hoặc dimetylformamit.

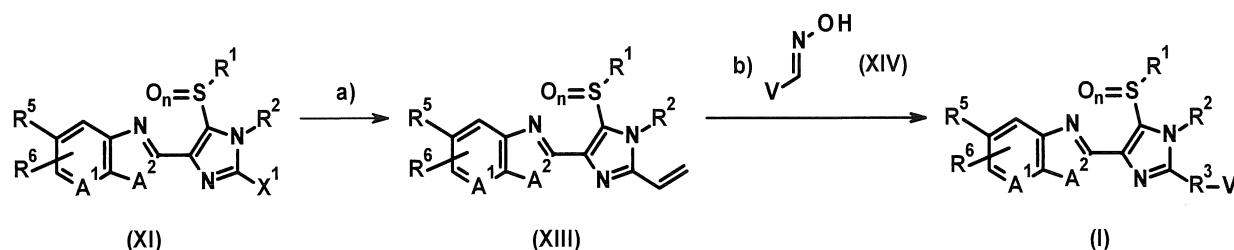
Hợp chất mong muốn có công thức H-V là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết.

Các hợp chất có công thức (I) trong đó R^3 -V là vòng đôi được gắn với phần còn lại của phân tử thông qua cacbon có thể được điều chế, ví dụ từ các hợp chất có công thức (XII), trong đó X^2 tốt hơn là halogen từ nhóm clo hoặc brom, bằng các phương pháp thông thường đã biết (tham khảo tài liệu *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

Ví dụ, các hợp chất có công thức (XII) trong đó X^2 tốt hơn là clo hoặc brom có thể được phản ứng với các axit arylboronic thích hợp hoặc este của chúng bằng các phương pháp đã biết (tham khảo tài liệu WO 2010/071819) với sự có mặt của các chất xúc tác thích hợp từ các nhóm gồm các muối kim loại chuyển tiếp để thu được các hợp chất có công thức (I). Ví dụ về các chất xúc tác kết hợp được ưu tiên bao gồm các chất xúc tác paladi như [1,1'-bis(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II) hoặc tetrakis(triphenylphosphin)paladi. Các chất phụ trợ phản ứng bazơ thích hợp được sử dụng để tiến hành các quy trình này tốt hơn là các cacbonat của natri hoặc kali.

Một số axit (hetero)arylboronic hoặc este (hetero)arylboronic cần thiết là đã biết và/hoặc có bán trên thị trường, hoặc chúng có thể được điều chế bằng các phương pháp thông thường đã biết (xem trong tài liệu *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

Quy trình D (khi R^3 -V là U-57)



Các gốc R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 và V có nghĩa như được mô tả ở trên. A^1 là N hoặc CH và A^2 là -N- R^4 , O hoặc S, trong đó R^4 có nghĩa như được mô tả ở trên. X^1 là halogen.

n là 0, 1 hoặc 2.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XI) được chuyển đổi thành các hợp chất có công thức (XIII) tương tự như quy trình A, bước b).

Bước b)

Các hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế từ các dẫn xuất vinyl có công thức (XIII), ví dụ bằng phản ứng với chất phản ứng halogen hóa như *N*-closuxinimit (NCS) trong dung môi như trichlometan, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO 2009/067613 hoặc *Bulletin Chemical Society Japan* **1984**, 57, 2184-2187.

Các aldoxim có công thức (XIV) là có sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu US 2007/037816.

Phương pháp và việc sử dụng

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

Sáng chế còn bộc lộ việc sử dụng hợp chất có công thức (I) làm thuốc diệt sinh vật gây hại, nhất là thuốc bảo vệ cây trồng.

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

Các hợp chất có công thức (I), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật máu nóng và tương thích tốt với môi trường, thích hợp để bảo vệ thực vật và các cơ quan của thực vật chống lại các yếu tố bất lợi sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu sau thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, nhất là côn trùng, nhện, giun sán, đặc biệt là giun tròn

và động vật thân mềm, các loại này thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong trồng rừng, trong các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu lưu kho, và trong lĩnh vực vệ sinh.

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

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

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

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

Các hợp chất có công thức (I) tốt hơn là có thể được sử dụng làm chất diệt sinh vật gây hại. Các hợp chất này có hoạt tính chống lại các loài nhện và kháng thuốc thông thường và cũng chống lại tất cả hoặc các giai đoạn phát triển cụ thể. Các sinh vật gây hại nêu trên bao gồm:

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

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

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

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

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

thuộc bộ cánh cứng (Coleoptera), ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus* spp., ví dụ *Agrilus planipennis*, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp., ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., ví dụ *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conorus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., ví dụ *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp., ví dụ *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., ví dụ *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloborus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., ví dụ *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., ví dụ *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscua*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., ví dụ *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasiorma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp.,

Lema spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Limoni* *ectypus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (=Hyperodes) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthora*, *Lyctus* spp., *Megacyllene* spp., ví dụ *Megacyllene robiniae*, *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., ví dụ *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., ví dụ *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., ví dụ *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., ví dụ *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., ví dụ *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., ví dụ *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Scolytus* spp., ví dụ *Scolytus multistriatus*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., ví dụ *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., ví dụ *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., ví dụ *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., ví dụ *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogormia* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., ví dụ *Zabrus tenebrioides*;

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

thuộc bộ hai cánh (Diptera), ví dụ *Aedes* spp., ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp.,

Chrysozona pluvialis, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., ví dụ *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., ví dụ *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., ví dụ *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., ví dụ *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., ví dụ *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hyporma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* hoặc *Pegomyia* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilidae casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiptosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ cánh nửa (Hemiptera), ví dụ *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrata*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., ví dụ *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., ví dụ *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., ví dụ *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., ví dụ *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp.,

Brevicoryne brassicae, *Cacopsylla* spp., ví dụ *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., ví dụ *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., ví dụ *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., ví dụ *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., ví dụ *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., ví dụ *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., ví dụ *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., ví dụ *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., ví dụ *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lili*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., ví dụ *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., ví dụ *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., ví dụ *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., ví dụ *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., ví dụ *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., ví dụ *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., ví dụ *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., ví dụ

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

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

thuộc bộ cánh màng (Hymenoptera), ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., ví dụ *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius*

spp., *Linepithema* (*Iridiomymex*) *humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., ví dụ *Sirex noctilio*, *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocetus* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

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

thuộc bộ cánh bằng (*Isoptera*), ví dụ *Coptotermes* spp., ví dụ, *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Kaloterms* spp., *Microtermes obesi*, *Nasutitermis* spp., *Odontotermes* spp., *Porotermes* spp., *Reticulitermes* spp., ví dụ, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

thuộc bộ cánh vẩy (*Lepidoptera*), ví dụ *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., ví dụ *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., ví dụ *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., ví dụ *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., ví dụ *Anticarsia gemmatilis*, *Argyroplote* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., ví dụ *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., ví dụ *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Dioryctria* spp., ví dụ *Dioryctria zimmermani*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., ví dụ *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp., *Eudocima* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., ví dụ *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., ví dụ *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., ví dụ *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliiothis* spp., ví dụ *Heliiothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes*

orbonalis, *Leucoptera* spp., ví dụ *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., ví dụ *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., ví dụ *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., ví dụ *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., ví dụ *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphisa* spp., *Operophtera* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., ví dụ *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., ví dụ *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., ví dụ *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., ví dụ *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., ví dụ *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Podesia* spp., ví dụ *Podesia syringae*, *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., ví dụ *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia* bao gồm, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., ví dụ *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., ví dụ *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., ví dụ *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., ví dụ *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stenoma* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., ví dụ *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

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

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

thuộc bộ rệp, sáp, mọt (*Psocoptera*), ví dụ, *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

thuộc bộ Cánh ống (*Siphonaptera*), ví dụ, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalogenus* spp., ví dụ *Ctenocephalogenus canis*, *Ctenocephalogenus felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

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

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

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

sinh vật gây hại thuộc ngành thân mềm (*Mollusca*), ví dụ thuộc lớp hai mảnh vỏ (*Bivalvia*), ví dụ *Dreissena* spp.;

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

sinh vật gây hại thực vật thuộc ngành giun tròn (*Nematoda*), tức là, giun tròn ký sinh trên thực vật, cụ thể là *Aglenchus* spp., ví dụ *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., ví dụ *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., ví dụ *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., ví dụ *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., ví dụ *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., ví dụ *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., ví dụ *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., ví dụ *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., ví dụ *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globora* spp., ví dụ *Globora pallida*, *Globora rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., ví dụ *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterora* spp., ví dụ *Heterora avenae*, *Heterora glycines*, *Heterora schachtii*, *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., ví dụ *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., ví dụ *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne*

fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., ví dụ Paratrichodorus minor, Paratylenchus spp., Pratylenchus spp., ví dụ Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctora spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., ví dụ Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., ví dụ Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., ví dụ Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., ví dụ Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., ví dụ Xiphinema index.

Các hợp chất có công thức (I), ở nồng độ hoặc tỷ lệ áp dụng nhất định, tùy từng trường hợp, cũng có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc chất để cải thiện đặc tính của thực vật, làm chất diệt vi sinh vật hoặc chất diệt giao tử, ví dụ làm chất diệt nấm, chất chống nấm, chất diệt khuẩn, chất diệt virus (bao gồm cả các chất chống viroít) hoặc làm chất chống sinh vật giống mycoplasma (MLO - mycoplasma-like organisms) và sinh vật giống rickettsia (RLO - rickettsia-like organisms). Nếu có thể, chúng cũng có thể được sử dụng dưới dạng các hợp chất trung gian hoặc tiền chất để tổng hợp các hoạt chất khác.

Chế phẩm phối chế

Sáng chế còn đề cập đến các chế phẩm và dạng sử dụng được điều chế từ các chế phẩm này làm chất diệt sinh vật gây hại, ví dụ các dung dịch để ngâm, nhúng và phun, chứa ít nhất một hợp chất có công thức (I). Tùy ý, các dạng sử dụng còn chứa chất diệt sinh vật gây hại và/hoặc các chất bổ trợ mà cải thiện hoạt động, như chất xuyên thấm, ví dụ, dầu thực vật, ví dụ, dầu hạt cải, dầu hướng dương, dầu khoáng, ví dụ, dầu parafin, alkyl este của các axit béo thực vật, ví dụ, methyl este của dầu hạt cải hoặc methyl este của dầu đậu nành, hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất phân tán, ví dụ, alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ, các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ, amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng lưu giữ, ví dụ, dioctyl sulfosuccinat hoặc polyme hydroxypropylguar và/hoặc chất giữ ẩm, ví dụ, glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ, phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

Các chế phẩm thông thường là, ví dụ, chất lỏng hòa tan trong nước (SL), nhũ tương đặc (EC), nhũ tương trong nước (EW), huyền phù đặc (SC, SE, FS, OD), hạt phân

tán trong nước (WG), hạt (GR) và chế phẩm đặc đóng nang (CS); các chế phẩm này và các loại chế phẩm có thể khác được mô tả, ví dụ, bởi Crop Life International và trong tài liệu Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, được soạn bởi FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Các chế phẩm, ngoài một hoặc nhiều hợp chất có công thức (I), tùy ý bao gồm thêm các thành phần hoạt tính hóa nông.

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

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

Chất bổ trợ được sử dụng có thể là các chất thích hợp để truyền các đặc tính riêng biệt, như các đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học xác định, cho chế phẩm chứa hợp chất có công thức (I), hoặc cho các dạng sử dụng được điều chế từ các chế phẩm này (ví dụ, các chất diệt sinh vật gây hại sẵn sàng để sử dụng như dung dịch phun hoặc các sản phẩm phủ ngoài hạt).

Các chất độn thích hợp là, ví dụ, nước, các hóa chất lỏng hữu cơ phân cực và không phân cực, ví dụ từ các loại hydrocacbon thơm và không thơm (như parafin, alkylbenzen, alkylnaphtalen, clobenzen), các rượu và polyol (nếu thích hợp, các loại này cũng có thể được thế, este hóa và/hoặc este hóa), các keton (như axeton, xyclohexanon), các este (bao gồm chất béo và dầu) và các (poly)ete, các amin, amit, lactam (như N-alkylpyrrolidon) và lacton thông thường và được thế, các sulfon và sulfoxit (như dimetyl sulfoxit) các cacbonat và các nitril.

Nếu chất độn được sử dụng là nước, cũng có thể sử dụng, ví dụ, các dung môi hữu cơ làm trợ dung môi. Về cơ bản, các dung môi lỏng thích hợp là: dung môi thơm như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, dung môi thơm được clo hóa hoặc hydrocacbon béo được clo hóa như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, hydrocacbon béo như xyclohexan hoặc parafin, ví dụ, các phân đoạn dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, rượu như butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, xeton như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton hoặc xyclohexanon, các dung môi phân cực mạnh như dimetylformamit hoặc dimetyl sulfoxit, cacbonat như propylen cacbonat, butylen cacbonat, dietyl cacbonat hoặc dibutyl cacbonat, hoặc nitril như axetonitril hoặc propannitril.

Về nguyên tắc, có thể sử dụng tất cả các dung môi thích hợp. Ví dụ về các dung môi thích hợp là các hydrocacbon thơm, như xylen, toluen hoặc alkylnaphtalen, các hydrocacbon thơm clo hóa hoặc các hydrocacbon béo clo hóa, như clobenzen, cloetylen hoặc metylen clorua, các hydrocacbon béo, như xyclohexan, parafin, các phân đoạn dầu mỏ, dầu khoáng và dầu thực vật, các rượu như metanol, etanol, isopropanol, butanol hoặc glycol và các ete và este của chúng, các keton như axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton hoặc xyclohexanon, các dung môi phân cực mạnh như dimetyl sulfoxit, các cacbonat như propylen cacbonat, butylen cacbonat, dietyl cacbonat hoặc dibutyl cacbonat, các nitril như axetonitril hoặc propannitril, và cả nước.

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

Còn có thể sử dụng chất độn hoặc dung môi khí hóa lỏng. Đặc biệt thích hợp là các chất độn hoặc chất mang ở trạng thái khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và áp suất khí quyển,

ví dụ chất đẩy sol khí như các hydrocacbon được halogen hóa, và cả butan, propan, nito và cacbon dioxit.

Ví dụ về chất nhũ hóa và/hoặc chất tạo bọt, chất phân tán hoặc chất làm ẩm có các đặc tính ion hoặc không ion, hoặc hỗn hợp của các chất hoạt động bề mặt này, đó là các muối của axit polyacrylic, muối của axit lignosulfonic, muối của axit phenolsulfonic hoặc axit naphtalensulphonic, chất đa trùng ngưng của etylen oxit với các rượu béo hoặc với các axit béo hoặc với các amin béo, với các phenol được thế (tốt hơn là alkylphenol hoặc arylphenol), các muối của este sulphosuxinic, các dẫn xuất taurin (tốt hơn là alkyl taurat), các dẫn xuất isethionat, các este phosphoric của các rượu hoặc phenol polyetoxyl hóa, các este của axit béo của các polyol, và các dẫn xuất của hợp chất chứa sulfat, sulfonat và phosphat, ví dụ alkylaryl polyglycol ete, alkylsulfonat, alkyl sulphat, arylsulfonat, sản phẩm thủy phân protein, dịch thải lignosulphit và metylxenluloza. Sự có mặt của chất hoạt diện là thuận lợi nếu như một trong số các hợp chất có công thức (I) và/hoặc một trong số các chất mang trợ không hòa tan được trong nước và nếu việc áp dụng diễn ra trong nước.

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

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

Ngoài ra, các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này cũng có thể chứa, dưới dạng chất phụ trợ bổ sung, chất kết dính như carboxymetylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gồm arabic, rượu polyvinyllic và polyvinyl axetat, hoặc còn các phospholipit tự nhiên như xephalin và

lexithin và các phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ khác có thể là dầu khoáng và dầu thực vật.

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

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

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

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

Hàm lượng của hợp chất có công thức (I) trong các dạng sử dụng được bào chế từ các chế phẩm này (cụ thể là chất diệt sinh vật gây hại) có thể thay đổi trong phạm vi

rộng. Nồng độ của hợp chất có công thức (I) trong các dạng sử dụng có thể thông thường nằm trong khoảng từ 0,00000001% đến 95% khối lượng là hợp chất có công thức (I), tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,00001% đến 1% khối lượng, tính theo khối lượng của dạng sử dụng. Các hợp chất được sử dụng theo cách thức thông thường thích hợp với các dạng sử dụng.

Hỗn hợp

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

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

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

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

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

Các hoạt chất được xác định rõ ở đây bằng tên chung của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ trong tài liệu "The Pesticide Manual", 16th ed., British Crop Protection Council 2012, hoặc có thể tìm trên internet (ví dụ <http://www.alanwood.net/pesticides>). Việc phân loại dựa trên hệ thống phân loại IRAC Mode of Action Classification Scheme áp dụng ở thời điểm nộp đơn sáng chế này.

(1) Các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE), tốt hơn là các carbamat được chọn từ alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, metomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC và xylylcarb; hoặc các hợp chất hữu cơ phosphat, ví dụ axephat, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-metyl, cadusafos, chloretoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, clopyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos, demeton-S-metyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, đimetoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, etoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(metoxyaminothiophosphoryl) salixylat, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, metidation, mevinphos, monocrotopho, naled, ometoat, oxytmetonmetyl, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

(2) Các chất phong bế kênh clorua đóng mở cổng bởi GABA, tốt hơn là các xyclodien-clo hữu cơ được chọn từ chlordane và endosulfan hoặc phenylpyrazol (fiprol) được chọn từ ethiprol và fipronil.

(3) Các chất điều biến kênh natri, tốt hơn là các pyrethroid được chọn từ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin S-xycllopentenyl, bioresmethrin, xyclprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lamda-cyhalothrin, gama-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], deltamethrin, empenthrin [chất đồng phân (EZ)-(1R)], esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinat, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momflothrín, permethrin, phenothrin [chất đồng phân (1R)-trans], prallethrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [chất đồng phân (1R)], tralomethrin và transfluthrin hoặc DDT hoặc metoxyclo.

(4) Các chất điều biến cạnh tranh của thụ thể axetylcholin nicotinic (Nicotinic acetylcholine receptor - nAChR), tốt hơn là các neonicotinoit được chọn từ axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiametoxam hoặc nicotin hoặc sulfoximin được chọn từ sulfoxaflor hoặc butenolit được chọn từ flupyradifuron.

(5) Các chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholin nicotinic (nAChR), tốt hơn là các spinosyn được chọn từ spinetoram và spinosad.

(6) Các chất điều biến dị lập thể của kênh clorua đóng mở cổng bởi glutamat (Glutamate-gated chloride channel - GluCl), tốt hơn là các avermectin/milbemycin được chọn từ abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất bắt chước hocmon ấu trùng, tốt hơn là các chất tương tự hormon ấu trùng được chọn từ hydropren, kinopren và metopren hoặc fenoxycarb hoặc pyriproxyfen.

(8) Các chất ức chế không đặc hiệu (nhiều vị trí) hỗn tạp, tốt hơn là các alkyl halogenua được chọn từ metyl bromua và các alkyl halogenua khác; hoặc clopicrin hoặc sulfuryl florua hoặc thuốc gây nôn borac hoặc tartar hoặc chất tạo metyl isoxyanat được chọn từ diazomet và metam.

(9) Các chất điều biến kênh TRPV của cơ quan dây âm được chọn từ pymetrozine và pyrifluquinazon.

(10) Các chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét được chọn từ clofentezin, hexythiazox, diflovidazin và etoxazol.

(11) Các chất phá vỡ vi sinh vật của màng ruột côn trùng được chọn từ *Bacillus thuringiensis* loài phụ *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* loài phụ *tenebrionis*, và các protein thực vật *B.t.* được chọn từ Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb và Cry34Ab1/35Ab1.

(12) Các chất ức chế ATP syntaza ty thể, tốt hơn là các chất phá vỡ ATP được chọn từ diafenthiuron, hoặc các hợp chất hữu cơ-thiếc được chọn từ azocyclotin, cyhexatin và fenbutatin oxit, hoặc propargite hoặc tetradifon;

(13) Chất phân tách quá trình phosphoryl hóa oxy hóa bằng cách làm gián đoạn gradien proton được chọn từ clorfenapyr, DNOC và sulfluramid.

(14) Các chất phong bế kênh của thụ thể axetylcholin nicotinic được chọn từ bensultap, cartap hydroclorua, thiocyclam và thiosultap-natri.

(15) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 0, được chọn từ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.

(16) Các chất ức chế sinh tổng hợp chitin, loại 1 được chọn từ buprofezin.

(17) Các chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt trong trường hợp bộ hai cánh) được chọn từ cyromazine.

(18) Các chất chủ vận thụ thể ecdyson (hormon lột xác), được chọn từ chromafenozid, halofenozid, metoxyfenozid và tebufenozid.

(19) Các chất chủ vận octopamin được chọn từ amitraz.

(20) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp III của ty thể được chọn từ hydrametylnon, acequinocyl và fluacrypyrim;

(21) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp I của ty thể, tốt hơn là các chất diệt ve bét METI được chọn từ fenazaquin, fenpyroximat, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad và tolfenpyrad, hoặc rotenon (Derris).

(22) Các chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế được chọn từ indoxacarb và metaflumizon.

(23) Các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, tốt hơn là các dẫn xuất của axit tetronic và axit tetramic được chọn từ spirodiclofen, spiromesifen và spirotetramat;

(24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp IV của ty thể, tốt hơn là các phosphin được chọn từ nhôm phosphua, canxi phosphua, phosphin và kẽm phosphua, hoặc các xyanua được chọn từ canxi xyanua, kali xyanit và natri xyanit.

(25) Chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II của ty thể, tốt hơn là các dẫn xuất beta-keto nitril được chọn từ cyenopyrafen và cyflumetofen, hoặc các carboxanilit được chọn từ pyflubumide;

(28) Các chất điều biến thụ thể ryanodin, tốt hơn là các diamit được chọn từ chlorantraniliprol, xyantraniliprol và flubendiamit.

(29) Các chất điều biến cơ quan dây âm (với cấu trúc đích không xác định) được chọn từ flonicamid.

(30) Các hoạt chất khác được chọn từ acynonapryr, afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclotiaz, benzoximate, benzpyrimoxan, bifenazate, broflanilide, bromopropylate, chinomethionat, cloprallethrin, cryolite, cyclaniliprole, xyclozaprid, cyhalodiamide, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoquin, fluazaindolizine, fluensulfone, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprole, fluhexafon, fluopyram, flupyrimin, fluralaner, fluxametamide, fufenozide, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodion, kappa bifenthrin, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, oxazosulfyl, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spiobudiclofen, spiropidion, tetrametylfluthrin, tetraniliprole, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim và iodometan; các chế phẩm khác dựa trên *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), và các hợp chất sau đây: 1-{2-flo-4-metyl-5-[(2,2,2-trifloetyl)sulfinyl]phenyl}-3-(triflometyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (đã biết trong tài liệu WO 2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (đã biết trong tài liệu WO 2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (đã biết

trong tài liệu WO 2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-one (đã biết trong tài liệu WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl etylcacbonat (đã biết trong tài liệu EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetylpiperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết trong tài liệu WO 2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết trong tài liệu JP2010/018586) (CAS Reg.No. 1204776-60-2), (3E)-3-[1-[(6-clo-3-pyridyl)metyl]-2-pyridyliden]-1,1,1-triflopropan-2-on (đã biết trong tài liệu WO 2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentafluoetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết trong tài liệu WO 2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoil)phenyl]-2-(3-clo-2-pyridyl)pyrazol-3-carboxamit (đã biết trong tài liệu CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit, 4-[5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(trans-1-oxido-3-thietanyl)benzamit và 4-[(5S)-5-(3,5-diclophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-2-metyl-N-(cis-1-oxido-3-thietanyl)benzamit (đã biết trong tài liệu WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit, (+)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit và (-)-N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)sulfinyl]propanamit (đã biết trong tài liệu WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[2E)-3-clo-2-propen-1-yl]amino]-1-[2,6-diclo-4-(triflometyl)phenyl]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1H-pyrazol-3-carbonitril (đã biết trong tài liệu CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-clo-2-metyl-6-[(metylamino)thioxometyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (Liudaibenjiaxuanan, đã biết trong tài liệu CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-clo-2-[[1,1-dimetyletyl]amino]carbonyl]-6-metylphenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-3-(flometoxy)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết trong tài liệu WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-yl)-4-clo-6-metylphenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết trong tài liệu WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-diclo-4-[(3,3-diclo-2-propen-1-

yl)oxy]phenoxy]propoxy]-2-metoxi-6-(triflometyl)pyrimidin (đã biết trong tài liệu CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- và 2(Z)-2-[2-(4-xyanophenyl)-1-[3-(triflometyl)phenyl]etyliden]-N-[4-(diflometoxy)phenyl]hydrazincarboxamit (đã biết trong tài liệu CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); 3-(2,2-dicloethenyl)-2,2-dimetyl-4-(1H-benzimidazol-2-yl)phenyl este của axit xyclopropanecarboxylic (đã biết trong tài liệu CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4aS)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[4-(metoxycarbonyl)-4-[[4-(triflometyl)thio]phenyl]amino]carbonyl]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H)-carboxylic (đã biết trong tài liệu CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-O-etyl-2,4-di-O-metyl-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoetoxy)phenyl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl]phenyl]carbamit]- α -L-mannopyranose (đã biết trong tài liệu US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3,2,1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3,2,1]octan (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-xyclopropylmetoxy-4-triflometylphenoxy)-3-(6-triflometylpyridazin-3-yl)-3-azabixyclo[3,2,1]octan (đã biết trong tài liệu WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-clo-1-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-etyl-3-[(3,3,3-triflopropyl)thio]propanamit (đã biết trong tài liệu WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và N-[4-(aminothioxometyl)-2-metyl-6-[(metyl amino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết trong tài liệu CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)-4-[[4-(triflometyl)phenyl]metoxy]pyrimidin (đã biết trong tài liệu WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-1,8-diazaspiro[4.5]decan-2,4-dion (đã biết trong tài liệu WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etyl 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-8-metoxi-1-metyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-ylcarboxylat (đã biết trong tài liệu WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), 4-[(5S)-5-(3,5-diclo-4-flophenyl)-4,5-dihydro-5-(triflometyl)-3-isoxazolyl]-N-[(4R)-2-etyl-3-oxo-4-isoxazolidinyl]-2-metylbenzamit (đã biết trong tài liệu WO 2011/067272, WO 2013/050302) (CAS 1309959-62-3).

Các chất diệt nấm

Các hoạt chất được xác định ở đây bằng tên chung của chúng là đã biết và được mô tả, ví dụ, trong tài liệu "Pesticide Manual" (16th Ed. British Crop Protection Council) hoặc có thể tra cứu trên mạng Internet (ví dụ: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

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

1) Chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.001) cyproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamide, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamine, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfat, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) prothioconazol, (1.019) pyrisoxazol, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xyclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1R)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-cloxypropyl)-4-[(1S)-2,2-dicloxypropyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.036) [3-(4-clo-2-flophenyl)-5-(2,4-diflophenyl)-1,2-oxazol-4-yl](pyridin-3-yl)metanol, (1.037) 1-[(2R,4S)-2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-4-metyl-1,3-dioxolan-2-yl]metyl-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-[(2S,4S)-2-[2-clo-4-(4-

clophenoxy)phenyl]-4-methyl-1,3-dioxolan-2-yl)methyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.041) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimethylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.056) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thione, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-methyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)xylopentanol, (1.060) 5-(allylsulfanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl)methyl]-1H-1,2,4-triazol,

(1.063) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,2-trifloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.069) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(pentafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(diflometoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-[(diflometyl)sulfanyl]phenoxy}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yloxy)-2-metylpyridin-3-yl]-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.075) N'-{4-[(4,5-diclo-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylxyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-diflophenyl)etoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.081) mefentrifluconazol, (1.082) ipfentrifluconazol.

2) Chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức I hoặc II, ví dụ (2.001) benzovindiflupyr, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr, (2.009) isofetamid, (2.010) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1R,4S,9S), (2.011) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng anti-epime 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (chất triệt quang dạng anti-epime

1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (hỗn hợp của chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS và chất triệt quang dạng anti-epime 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (chất đồng phân đối ảnh dạng syn-epime 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (chất triệt quang dạng syn-epime 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen, (2.020) pyraziflumid, (2.021) sedaxane, (2.022) 1,3-dimetyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.023) 1,3-dimetyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.024) 1,3-dimetyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.025) 1-metyl-3-(triflometyl)-N-[2'-(triflometyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.026) 2-flo-6-(triflometyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamide, (2.027) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.028) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) 3-(diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxypopan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-

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

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức III, ví dụ (3.001) ametoctradin, (3.002)
 amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumetoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin,
 (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon,
 (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-
 metyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017)
 pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019) pyraoxystrobin, (3.020) trifloxystrobin
 (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-flo-2-
 phenylvinyl]oxy}phenyl)etyliden]amino}oxy)metyl]phenyl}-2-(metoxyimino)-N-
 metylaxetamit, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-
 (metoxyimino)-N,3-dimetylpen-3-enamiy, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-
 dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxy-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-

dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypyridin-2-yl)carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamid, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamid.

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

5) Các hợp chất có khả năng hoạt động nhiều vị trí, ví dụ (5.001) hỗn hợp bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) chlorthalonil, (5.005) đồng hydroxit, (5.006) đồng naphtenat, (5.007) đồng oxit, (5.008) đồng oxyclorea, (5.009) đồng(2+) sulfat, (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) kẽm metiram, (5.017) oxin-đồng, (5.018) propineb, (5.019)

lưu huỳnh và chế phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etyl-5,7-dioxo-6,7-dihydro-5H-pyrolo[3',4':5,6][1,4]dithiino[2,3-c][1,2]thiazol-3-carbonitril.

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

7) Chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.001) cyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin hydroclorua hydrate, (7.004) oxytetracycline, (7.005) pyrimethanil, (7.006) 3-(5-flo-3,3,4,4-tetrametyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin.

(8) Các chất ức chế sản sinh ATP, ví dụ (8.001) silthiofam.

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

10) Chất ức chế tổng hợp lipid và màng, ví dụ (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb hydroclorua, (10.003) tolclofos-metyl.

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

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

13) Chất ức chế sự truyền tín hiệu, ví dụ (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodione, (13.003) procymidone, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.

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

15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.001) axit abscisic, (15.002) benthiazol, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamit, (15.011)

flutianil, (15.012) fosetyl-aluminium, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothioxyanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomicin, (15.018) natamycin, (15.019) nickel dimetyldithiocarbamate, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapiprolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclophenol và các muối, (15.025) axit phosphonic và các muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetylate, (15.027) pyriofenone (chlazafenone), (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanide, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15.033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) 2,6-dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrone, (15.035) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.036) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.037) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.038) 2-[6-(3-flo-4-metoxypheyl)-5-metylpyridin-2-yl]quinazolin, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.041) 2-{2-[(7,8-diflo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]-6-flophenyl}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-flo-6-[(8-flo-2-metylquinolin-3-yl)oxy]phenyl}propan-2-ol, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}-3-clophenyl metansulfonat, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]axetyl}piperidin-4-yl)-1,3-thiazol-4-yl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl}phenyl metansulfonat, (15.045) 2-phenylphenol và các muối của nó, (15.046) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.047) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng hồ biến: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-

phenyletyl)amino]butyric, (15.050) 5-amino-1,3,4-thiadiazol-2-thiol, (15.051) 5-clo-N'-phenyl-N'-(prop-2-yn-1-yl)thiophen 2-sulfonohydrazit, (15.052) 5-flo-2-[(4-flobenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.053) 5-flo-2-[(4-metylbenzyl)oxy]pyrimidin-4-amin, (15.054) 9-flo-2,2-dimetyl-5-(quinolin-3-yl)-2,3-dihydro-1,4-benzoxazepin, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(Z)-(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbammat, (15.056) etyl (2Z)-3-amino-2-xyano-3-phenylacrylat, (15.057) axit phenazin-1-carboxylic, (15.058) propyl 3,4,5-trihydroxybenzoat, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfat (2:1), (15.061) tert-butyl {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metyl]pyridin-2-yl}carbammat, (15.062) 5-flo-4-imino-3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on.

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học làm thành phần phối trộn

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

Các chất diệt sinh vật gây hại sinh học chủ yếu bao gồm vi khuẩn, nấm, nấm men, chất chiết thực vật và các sản phẩm được tạo ra bởi các vi sinh vật, bao gồm protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp.

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

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

Bacillus amyloliquefaciens, chủng FZB42 (DSM 231179), hoặc *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 hoặc *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (mã số truy cập CNCM I-1582) hoặc *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng GB34 (mã số truy cập ATCC 700814) và chủng QST2808 (mã số truy cập NRRL B-30087), hoặc *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng GB03 (mã số truy cập ATCC SD-1397), hoặc *Bacillus subtilis* chủng QST713 (mã số truy cập NRRL B-21661) hoặc *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (mã số truy cập NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), chủng AM65-52 (mã số truy

cập ATCC 1276), hoặc *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là chủng ABTS-1857 (SD-1372), hoặc *B. thuringiensis subsp. kurstaki* chủng HD-1, hoặc *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* chủng NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Rotylenchulus reniformis nematode)-PR3 (mã số truy cập ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31,013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (mã số truy cập NRRL 30232).

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

Beauveria bassiana, cụ thể là chủng ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, cụ thể là chủng CON/M/91-8 (mã số truy cập DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, cụ thể là chủng HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii* (trước đây được biết là *Verticillium lecanii*), cụ thể là chủng KV01, *Metarhizium anisopliae*, cụ thể là chủng F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, cụ thể là chủng NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (new: *Isaria fumosorosea*), đặc biệt là chủng IFPC 200613, hoặc chủng Apopka 97 (mã số truy cập số ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, đặc biệt là *P. lilacinus* chủng 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, đặc biệt là chủng V117b, *Trichoderma atroviride*, đặc biệt là chủng SC1 (mã số truy cập số CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, đặc biệt là *T. harzianum rifai* T39 (mã số truy cập số CNCM I-952).

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

Virus thể hạt (GV) *Adoxophyes orana* (bướm trái cây mùa hè), virus thể hạt (GV) *Cydia pomonella* (ấu trùng sâu bướm), virus đa diện nhân (NPV) *Helicoverpa armigera* (giun nang ở bông), *Spodoptera exigua* (sâu xanh da láng) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (sâu xanh mùa thu) mNPV, *Spodoptera littoralis* (sâu ăn lá bông châu Phi) NPV.

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

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

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

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

Chất an toàn làm thành phần phối trộn

Các hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với các chất an toàn, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamid, dichlormid, fenclorazol (-etyl), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etyl), mefenpyr (-dietyl), anhydrit, naphtalic, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metylcarbamoil)amino]phenyl}sulfonyl)benzamid (CAS 129531-12-0), 4-(dicloaxetyl)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decan (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetyl-3-(dicloaxetyl)-1,3-oxazolidin (CAS 52836-31-4).

Thực vật và các bộ phận của thực vật

Tất cả các thực vật và các bộ phận của thực vật có thể được xử lý theo sáng chế. Thực vật được hiểu trong bản mô tả này có nghĩa là tất cả các thực vật và quần thể thực vật, như các cây hoang dại mong muốn và không mong muốn hoặc cây trồng (bao gồm các cây trồng có trong tự nhiên), ví dụ, cây ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa

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

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

Như đã đề cập ở trên, có thể xử lý tất cả các thực vật và bộ phận của chúng theo sáng chế. Theo một phương án ưu tiên, các loài thực vật hoang dại và giống thực vật, hoặc các loài thu được bằng phương pháp nhân giống sinh học thông thường, như lai giống hoặc dung hợp tế bào trần, và các bộ phận của chúng, được xử lý. Theo một phương án ưu tiên, thực vật chuyển gen và giống thực vật thu được bằng các phương pháp xử lý bằng kỹ thuật di truyền, nếu thích hợp, kết hợp với các phương pháp thông thường (sinh vật biến đổi gen), và các bộ phận của chúng được xử lý. Thuật ngữ “bộ phận” hoặc “bộ phận của thực vật” hoặc “bộ phận thực vật” đã được giải thích trên đây. Theo sáng chế, tốt hơn là xử lý thực vật thuộc các giống thông thường trên thị trường

tương ứng hoặc các giống đang sử dụng. Các giống cây trồng được hiểu là thực vật có các đặc tính ("tính trạng") mới và thu được bằng phương pháp nhân giống thông thường, bằng các kỹ thuật gây đột biến hoặc các kỹ thuật ADN tái tổ hợp. Giống thực vật có thể là cây giống, giống, kiểu sinh học hoặc kiểu gen.

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

Thực vật hoặc giống thực vật chuyển gen (các loài thu được bằng kỹ thuật di truyền) ưu tiên cần được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các thực vật mà, thông qua sự biến đổi di truyền, nhận được vật liệu di truyền mà sẽ truyền các đặc tính ("tính trạng") hữu ích đặc biệt có lợi cho các thực vật này. Ví dụ về các đặc tính này là sự sinh trưởng tốt hơn, khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp tăng, khả năng chịu hạn hoặc các mức nước hoặc độ mặn của đất tốt hơn, hiệu suất ra hoa tăng, thu hoạch dễ hơn, nhanh chín hơn, năng suất thu hoạch cao hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng cao hơn của các sản phẩm được thu hoạch, khả năng bảo quản và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn. Các ví dụ khác và được đặc biệt nhấn mạnh về các đặc tính như vậy là tăng tính chống chịu của thực vật đối với các động vật và vi sinh vật gây hại, như chống lại côn trùng, nhện, giun tròn, ve bét, ốc sên và ốc, ví dụ nhờ các độc tố được tạo ra trong thực vật, đặc biệt là các độc tố được tạo ra trong thực vật bằng vật liệu di truyền từ *Bacillus thuringiensis* (ví dụ, bởi các gen CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb và CryIF và cả tổ hợp của các gen này), và cả tăng tính chống chịu của thực vật đối với nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh thực vật, ví dụ, gây ra bởi tính kháng tập nhiễm hệ thống (systemic acquired resistance - SAR), systemin, phytoalexin, chất kích thích và các gen kháng và các protein và độc tố được biểu hiện tương ứng, và còn tăng khả năng chịu của thực vật đối với một số hoạt chất diệt cỏ nhất định, ví dụ, các imidazolinon, sulphonylure, glyphosat hoặc phosphinothricin (ví dụ, gen "PAT"). Các gen truyền đặc tính ("tính trạng") mong muốn cũng có thể có mặt kết hợp với nhau trong thực vật chuyển gen. Ví dụ về thực vật chuyển gen đã nêu bao gồm các cây trồng quan trọng, như ngũ cốc (lúa mì, lúa, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía, cà chua, đậu Hà lan và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải hạt dầu và cả thực vật lấy quả (các loại quả là táo, lê, các loại quả chi cam chanh và nho), đặc biệt nhấn mạnh có thể kể đến ngô, đậu tương, lúa mì, lúa, khoai tây, bông, mía, thuốc lá và cải hạt dầu. Các

đặc tính (“tính trạng”) đặc biệt được nhấn mạnh là tăng tính chống chịu của thực vật đối với côn trùng, nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý

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

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

Trong trường hợp hoạt chất tác động theo đường hệ thống, hợp chất có công thức (I) cũng tiếp cận thực vật thông qua hệ rễ. Sau đó, thực vật được xử lý thông qua tác động của hợp chất có công thức (I) lên môi trường sống của thực vật. Điều này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách tưới ướt, hoặc bằng cách trộn vào trong đất hoặc dung dịch chất dinh dưỡng, tức là vị trí của thực vật (ví dụ, các hệ trồng trong đất hoặc trong nước) được thấm bởi dạng dịch lỏng chứa hợp chất có công thức (I), hoặc bằng cách đưa vào đất, tức là hợp chất có công thức (I) được đưa vào ở dạng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong vị trí của thực vật, hoặc bằng cách đưa nhỏ giọt (cũng thường được gọi là “bổ sung hóa chất”), tức là áp dụng dạng lỏng chứa hợp chất có công thức (I) được đưa vào từ đường chảy nhỏ giọt ở bề mặt hoặc dưới mặt đất trong một khoảng thời gian nhất định cùng với các lượng nước thay đổi ở các vị trí xác định ở gần các thực vật này. Trong trường hợp cây lúa, việc xử lý này cũng có thể được thực hiện bằng cách định lượng hợp chất có công thức (I) ở dạng áp dụng rắn (ví dụ, ở dạng hạt) vào trong cánh đồng lúa ngập nước.

Xử lý hạt

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

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

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

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

bằng lớp trung gian. Sáng chế cũng đề cập đến hạt, trong đó hợp chất có công thức (I) và thành phần phối trộn đã được áp dụng như một phần của lớp phủ hoặc là một lớp khác hoặc các lớp khác ngoài lớp phủ.

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

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

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

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

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

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

Như đã đề cập trên đây, việc xử lý hạt chuyển gen bằng hợp chất có công thức (I) cũng đặc biệt quan trọng. Việc này bao gồm hạt của các cây mà thường chứa ít nhất một gen khác loại có tác dụng kiểm soát sự biểu hiện của polypeptit có các đặc tính diệt côn trùng và/hoặc diệt giun tròn cụ thể. Gen khác loại trong hạt chuyển gen có thể có

nguồn gốc từ các vi sinh vật như *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* hoặc *Gliocladium*. Sáng chế đặc biệt phù hợp để xử lý hạt chuyển gen mà gồm ít nhất một gen khác loại từ *Bacillus* sp. Tốt hơn, nếu gen khác loại thu được từ *Bacillus thuringensis*.

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

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

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

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

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

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

Chất làm ẩm hữu dụng mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất mà tăng cường sự làm ẩm và thường dùng trong việc phối chế các hoạt chất hóa nông. Tốt hơn nếu sử dụng alkyl naphtalensulfonat, như diisopropyl hoặc diisobutyl naphtalensulfonat.

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

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

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

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

Các chất kết dính hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong các sản phẩm

xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza.

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

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

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

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

Sức khỏe của động vật

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

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

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

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

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

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

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

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

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

này có nghĩa là hợp chất có công thức (I) tiêu diệt sinh vật ký sinh tương ứng, ức chế sự sinh trưởng của nó, hoặc ức chế sự tăng sinh của nó.

Động vật chân khớp bao gồm, ví dụ, nhưng không chỉ giới hạn ở, thuộc bộ chấy rận (Anoplurida), ví dụ *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.;

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

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

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

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

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

thuộc phân lớp ve bét (Acarina) và bộ Metastigmata, ví dụ từ họ Argasidae như *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., từ họ Ixodidae như *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (chỉ gốc của ve bét nhiều vật chủ); thuộc bộ Mesostigmata như *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Railletia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; thuộc bộ Actiniedida (Prostigmata), ví dụ, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp.,

Myobia spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; và thuộc bộ *Acaridida* (*Astigmata*), ví dụ, *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp., *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

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

Mastigophora (*Flagellata*), như:

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

Parabasala: thuộc bộ *Trichomonadida*, ví dụ *Histomonas* spp., *Pentatrichomonas* spp., *Tetratrichomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.

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

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

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

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

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

Ví dụ về giun sán bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở:

sán lá đơn chủ: ví dụ: *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Trogglecephalus* spp.;

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

Thuộc bộ xyclophyllida, ví dụ: Andyra spp., Anoplocephala spp., Avitellina spp., Bertiella spp., Cittotaenia spp., Davainea spp., Diorchis spp., Diplopylidium spp., Dipylidium spp., Echinococcus spp., Echinocotyle spp., Echinolepis spp., Hydatigera spp., Hymenolepis spp., Joyeuxiella spp., Mesocetoides spp., Moniezia spp., Paranoplocephala spp., Raillietina spp., Stilesia spp., Taenia spp., Thysaniezia spp., Thysanosoma spp.

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

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

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

Thuộc bộ Rhabditina, ví dụ: Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Bronchonema spp., Bunostomum spp., Chabertia spp., Cooperia spp., Cooperioides spp., Crenosoma spp., Cyathostomum spp., xyclococercus spp., xyclodontostomum spp., Cylicocyclus spp., Cylicostephanus spp., Cyliodropharynx spp., Cystocaulus spp., Dictyocaulus spp., Elaphostrongylus spp., Filaroides spp., Globocephalus spp., Graphidium spp., Gyallocephalus spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Hyostrongylus spp., Marshallagia spp.,

Metastrongylus spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Neostrongylus spp., Nippostrongylus spp., Obeliscoides spp., Oesophagodontus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp.; Ornithostrongylus spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Paracooperia spp., Paracrenosoma spp., Paraflaroides spp., Parelaphostrongylus spp., Pneumocaulus spp., Pneumostrongylus spp., Poteriostomum spp., Protostrongylus spp., Spicocaulus spp., Stephanurus spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Teladorsagia spp., Trichonema spp., Trichostrongylus spp., Triodontophorus spp., Troglostrongylus spp., Uncinaria spp.

Thuộc bộ Spirurida, ví dụ: Acanthocheilonema spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Ascaris spp., Ascarops spp., Aspicularis spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Cercopithifilaria spp., Crassicauda spp., Dipetalonema spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp.; Draschia spp., Enterobius spp., Filaria spp., Gnathostoma spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Heterakis spp.; Litomosoides spp., Loa spp., Onchocerca spp., Oxyuris spp., Parabronema spp., Paraflaria spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Physaloptera spp., Probstmayria spp., Pseudofilaria spp., Setaria spp., Skjrabinema spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Strongyluris spp., Syphacia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Wuchereria spp.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến phương pháp điều trị tình trạng nhiễm sinh vật ký sinh, đặc biệt là nhiễm sinh vật ký sinh được chọn từ nhóm gồm sinh vật ngoại ký sinh và sinh vật nội ký sinh đã nêu ở đây, bằng cách sử dụng lượng hữu

hiệu hợp chất có công thức (I) cho động vật, đặc biệt là động vật không phải người, cần được điều trị.

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

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

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

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

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

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

Các hoạt chất minh họa từ nhóm gồm các chất diệt sinh vật ngoại ký sinh như các thành phần phối trộn bao gồm, mà không dự định chỉ giới hạn ở, chất diệt côn trùng và chất diệt ve bét được liệt kê chi tiết trên đây. Các hoạt chất khác có thể dùng được nêu

dưới đây theo phân loại nêu trên dựa trên sơ đồ phân loại cách thức tác động IRAC hiện nay: (1) Chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE); (2) chất phong bế kênh clorua qua cổng GABA; (3) chất điều biến kênh natri; (4) chất điều biến cạnh tranh của thụ thể axetylcholine nicotin (nAChR); (5) chất điều biến dị lập thể của thụ thể axetylcholine nicotin (nAChR); (6) chất điều biến dị lập thể kênh clorua qua cổng glutamat (GluCl); (7) chất giả hormon juvenile; (8) chất ức chế không đặc hiệu hỗn hợp (nhiều vị trí); (9) chất điều biến cơ quan dây âm vị; (10) chất ức chế sự sinh trưởng của ve bét; (12) chất ức chế ATP synthaza ti thể, như chất phá vỡ ATP; (13) chất phân tách phosphoryl hóa oxy hóa thông qua việc phá vỡ gradien proton; (14) chất phong bế kênh thụ thể axetylcholine nicotin; (15) chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 0; (16) chất ức chế sinh tổng hợp chitin, typ 1; (17) chất phá vỡ quá trình lột xác (đặc biệt trong trường hợp bộ hai cánh); (18) chất chủ vận thụ thể hormon kích thích trưởng thành và lột xác (ecdysone); (19) chất chủ vận thụ thể octopamin; (21) chất ức chế vận chuyển điện tử phức I ty thể; (25) chất ức chế vận chuyển điện tử phức II ty thể; (20) chất ức chế vận chuyển điện tử phức III ty thể; (22) chất phong bế kênh natri phụ thuộc điện thế; (23) chất ức chế axetyl CoA carboxylaza; (28) chất điều biến thụ thể ryanodin;

các hoạt chất có cơ chế hoạt động chưa biết hoặc không đặc hiệu, ví dụ fentriphanil, fenoxacrim, xyclopren, chlorobenzilat, chlordimeform, flubenzimin, dicyclanil, amidoflomet, quinomethionat, triarathen, clothiazoben, tetrasul, kali oleat, dầu mỏ, metoxadiazon, gossyplur, flutenzin, brompropylat, cryolit;

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

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

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

các neonicotinoit, ví dụ nithiazine

dicloromezotiaz, triflumezopyrim

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

triprene, epofenonane, diofenolan;

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

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

benzoylure, ví dụ fluazuron, penfluron,

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

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

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

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

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

từ nhóm benzimidazol và probenzimidazol, ví dụ: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, thiophanate, parbendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, thiabendazol, xyclobendazol, cambendazol, albendazol sulfoxit, albendazol, flubendazol;

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

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

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

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

thuộc nhóm aminoaxetonitril, ví dụ: monepantel;

thuộc nhóm paraherquamit, ví dụ: paraherquamit, derquantel;

thuộc nhóm salixylanilit, ví dụ: tribromsalan, bromoxanit, brotitanit, clioxanit, closantel, niclosamit, oxyclozanit, raxofloxan;

từ nhóm phenol được thế, ví dụ: nitroxylin, bithionol, disophenol, hexachlophen, niclofolan, meniclopholan;

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

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

từ nhóm piperazin, ví dụ: piperazin, hydroxyzin;

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

từ các nhóm khác, ví dụ: bunamidin, niridazol, resorantel, omphalotin, oltipraz, nitroscanat, nitroxylin, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanthone, hycanthone, hetolin, emetin, diethylcarbamazin, diclophen, diamfenetide, clonazepam, bephenium, amoscanat, clorsulon.

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

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

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

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

thuộc nhóm quinolon, ví dụ: enrofloxacin, pradofloxacin;

từ nhóm quinin, ví dụ: cloquin;

từ nhóm pyrimidin, ví dụ: pyrimethamine;

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

thuộc nhóm thiamin, ví dụ: amprolium;

thuộc nhóm lincosamit, ví dụ: clindamycin;

thuộc nhóm carbanilit, ví dụ: imidocarb;

từ nhóm nitrofurantoin, ví dụ: nifurtimox;

thuộc nhóm quinazolinon alkaloid, ví dụ: halofuginon;

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

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

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

Phòng trừ vật truyền

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

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

1) Muỗi

- *Anopheles*: sốt rét, bệnh giun chỉ;

- Culex: bệnh viêm não Nhật Bản, bệnh giun chỉ, các bệnh khác do virus gây ra, truyền các loại giun khác;
- Aedes: bệnh sốt vàng, bệnh sốt xuất huyết, các rối loạn do virus khác, bệnh giun chỉ;
- Simuliidae: truyền giun, đặc biệt là *Onchocerca volvulus*;
- Psychodidae: truyền leishmaniasis

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

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

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

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

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

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

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

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

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng trong phòng ngừa bệnh và/hoặc mầm bệnh được truyền bởi vật truyền. Do đó, theo một khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) để phòng trừ vật truyền, ví dụ, trong

nông nghiệp, trong làm vườn, trong lâm nghiệp, trong các khu vườn và trong các cơ sở giải trí và cả trong bảo vệ vật liệu và các sản phẩm lưu kho.

Bảo vệ các vật liệu công nghiệp

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

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

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

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

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

Kiểm soát động vật gây hại trong khu vực vệ sinh

Các hợp chất có công thức (I) thích hợp để phòng trừ động vật gây hại trong lĩnh vực vệ sinh. Cụ thể hơn, sáng chế có thể được sử dụng trong lĩnh vực bảo vệ trong gia đình, trong lĩnh vực bảo vệ vệ sinh và để bảo vệ các sản phẩm lưu kho, đặc biệt là để phòng trừ côn trùng, nhện, tích và ve bét bắt gặp trong các không gian kín như khu vực nhà ở, các sảnh nhà máy, văn phòng, cabin của phương tiện giao thông, các cơ sở nhân giống động vật. Để phòng trừ sinh vật gây hại, hợp chất có công thức (I) được sử dụng đơn độc hoặc kết hợp với các hoạt chất khác và/hoặc các chất phụ trợ. Chúng tốt hơn là được sử dụng trong các sản phẩm diệt côn trùng trong gia đình. Các hợp chất có công

thức (I) có hiệu quả chống lại các loài nhậy và kháng và chống lại tất cả các giai đoạn phát triển.

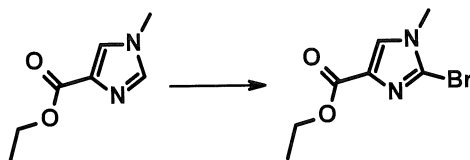
Các sinh vật gây hại này bao gồm, ví dụ, các sinh vật gây hại thuộc lớp Arachnida, thuộc các bộ Scorpiones, Araneae và Opiliones, thuộc các lớp Chilopoda và Diplopoda, thuộc lớp Insecta bộ Blattodea, thuộc các bộ Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera,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

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

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế:

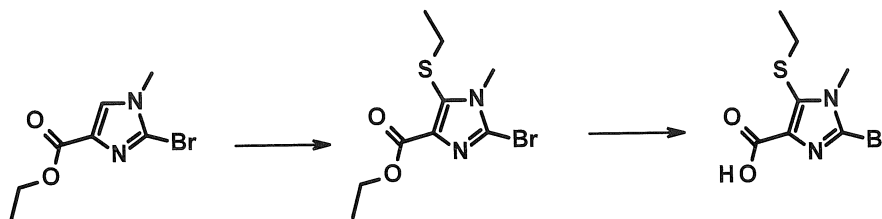
Etyl 2-bromo-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat (III-1)



30,0 g (195 mmol) etyl 1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylat được hòa tan trong 1,0 L tetrahydrofuran và được làm lạnh xuống 0°C. Bổ sung 34,5 g (195 mmol) *N*-bromosuxinimit vào dung dịch này từng chút một, và hỗn hợp phản ứng được khuấy ở nhiệt độ trong phòng qua đêm. Phản ứng được kết thúc bằng cách bổ sung dung dịch natri thiosulfat bão hòa (Na₂S₂O₃), và 800 ml etyl axetat được bổ sung. Các pha được tách ra và pha nước được chiết ba lần, mỗi lần bằng 800 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ được gộp lại, làm khô bằng natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất dưới áp suất giảm và phần còn lại được tinh chế bằng phương pháp tinh chế sắc ký cột sử dụng gradient ete dầu mỏ / etyl axetat (3:1) làm pha động.

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

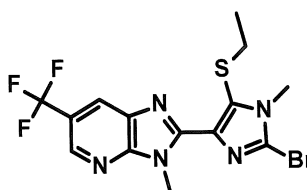
Axit 2-bromo-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic (X-1)



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

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 1,09 (t, 3H), 2,86 (q, 2H), 3,64 (s, 3H), 12,60 (s, 1H).

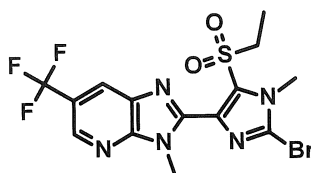
2-[2-Bromo-5-(etylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (XI-1)



Dung dịch chứa 4,99 g (18,8 mmol) axit 2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-carboxylic trong 30,5 ml pyridin được bổ sung 3,00 g (15,7 mmol) N²-metyl-5-(triflometyl)pyridin-2,3-diamin và 6,02 g (31,4 mmol) 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimit hydroclorua (EDCI). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 120°C qua đêm. Sau đó, hỗn hợp phản ứng được làm lạnh xuống nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp được giải phóng ra khỏi dung môi dưới áp suất giảm. Phần còn lại được tinh chế trên RP18 bằng phương pháp HPLC sử dụng pha động là axetonitril/nước + 0,1% axit formic.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) δ ppm: 1,115 (t, 3H), 3,02 (q, 2H), 3,76 (s, 3H), 4,06 (s, 3H), 8,535 (s, 1H), 8,77 (s, 1H).

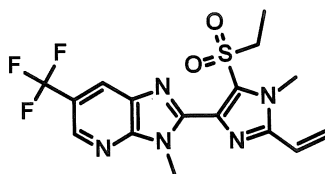
2-[2-Bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (XI-2)



3,22 g (7,66 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfanyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin được hòa tan trong 2,0 ml diclometan, ở nhiệt độ trong phòng, 1,45 ml (38,3 mmol) axit formic và 5,21 g (53,6 mmol) hydro peroxit được bổ sung và sau đó, hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Hỗn hợp được giải phóng ra khỏi dung môi dưới áp suất giảm. Sau đó, dung dịch được pha loãng bằng cách bổ sung diclometan và được rửa bằng dung dịch natri thiosulfat bão hòa. Pha hữu cơ được lấy ra, làm khô trên natri sulfat và lọc. Dung môi được chưng cất trong điều kiện áp suất giảm.

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) δ ppm: 1,29 (t, 3H), 3,76 (q, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 8,62 (s, 1H), 8,85 (s, 1H).

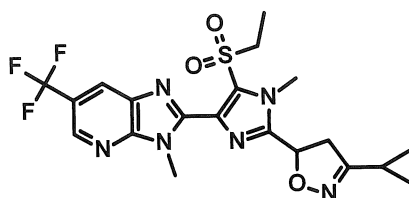
2-[5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-2-vinyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (XII-1)



Dung dịch chứa 624 mg (1,37 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin và 697 mg (2,20 mmol) tributyl(vinyl)stannan trong 2,9 ml *N,N*-dimetylformamit được khử khí bằng khí argon. 14,5 mg (0,021 mmol) paladibis(triphenylphosphin) diclorit được bổ sung và dung dịch được khuấy ở nhiệt độ 75°C trong 4 giờ. Hỗn hợp này được cô đặc. Tinh chế phần còn lại trên silicagel bằng phương pháp MPLC sử dụng pha động xyclohexan/etyl axetat.

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,72 (q, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,98 (s, 3H), 5,77 (dd, 1H), 6,36 (dd, 1H), 7,01 (dd, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,84 (s, 1H).

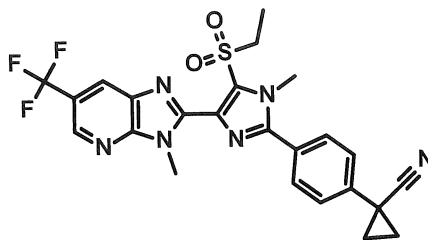
2-[2-(3-xyclopropyl-4,5-dihydro-1,2-oxazol-5-yl)-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (I-1)



Dung dịch chứa 107 mg (1,25 mmol) *N*-(xyclopropylmetylen)hydroxylamin, 167 mg (1,25 mmol) *N*-closuxinimit và 10,1 μl (0,125 mmol) pyridin được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 4,5 giờ. 100 mg (0,250 mmol) 2-[5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-2-vinyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin và 0,174 ml (1,25 mmol) trietylamin được bổ sung và dung dịch được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 18 giờ. Chiết hỗn hợp bằng nước/diclometan. Làm khô pha hữu cơ bằng natri sulfat, lọc và cô đặc. Tinh chế phần còn lại trên silicagel bằng phương pháp MPLC sử dụng pha động xyclohexan/etyl axetat. Phần mong muốn được tinh sạch trên RP18 bằng HPLC sử dụng pha động là axetonitril/nước.

$\log\text{P}[\text{axit}]$: 2,73; $\log\text{P}[\text{trung tính}]$: 2,72; MH^+ : 483; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 0,83 (m, 2H), 0,90 (m, 2H), 1,27 (t, 3H), 1,86 (m, 1H), 3,28 (dd, 1H), 3,60 (dd, 1H), 3,79 (m, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,98 (s, 3H), 5,91 (dd, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,84 (s, 1H).

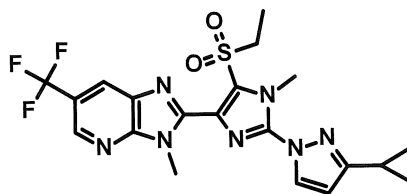
1-(4-{5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-4-[3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-1H-imidazol-2-yl}phenyl)xyclopropanecarbonitril (I-5)



Dung dịch chứa 150 mg (0,332 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin, 268 mg (0,995 mmol) 1-[4-(4,4,5,5-tetrametyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)phenyl]xyclopropanecarbonitril và 324 mg (0,995 mmol) xesi cacbonat trong 2,5 ml 1,4-dioxan và 0,55 ml nước được khử khí bằng argon. 38,2 mg (0,033 mmol) tetrakis(triphenylphosphin)paladi được bổ sung và dung dịch được khuấy ở nhiệt độ 110°C trong tủ vi sóng trong 30 phút. Hỗn hợp được cô. Phần còn lại được tinh chế trên RP18 bằng phương pháp HPLC sử dụng pha động axetonitril/nước.

logP[axit]: 3,14; logP[trung tính]: 3,07; MH^+ : 515; 1H -NMR (400 MHz, d_6 -DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 1,64 (m, 2H), 1,86 (m, 2H), 3,83 (q, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,965 (s, 3H), 7,54 (d, 2H), 7,85 (d, 2H), 8,61 (s, 1H), 8,85 (s, 1H).

2-[2-(3-xyclopropyl-1H-pyrazol-1-yl)-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin (I-9)

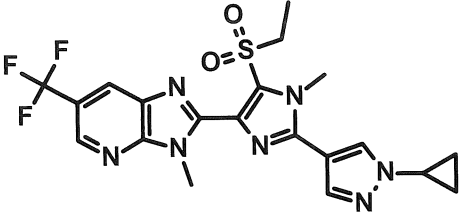
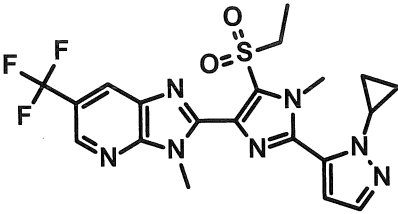
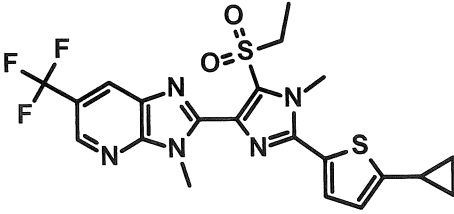
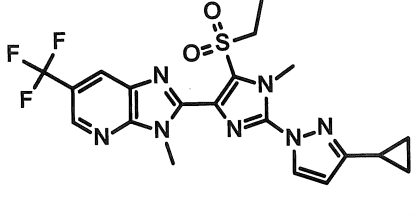
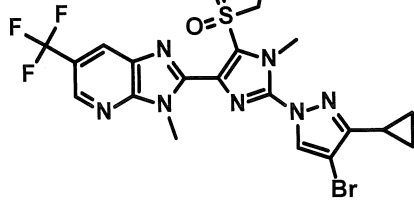
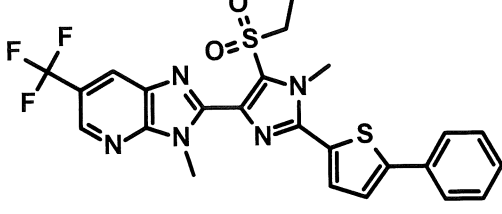
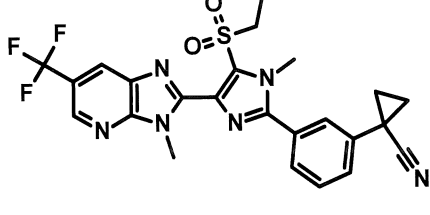


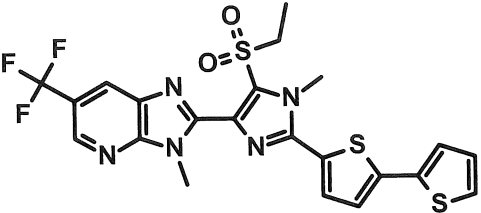
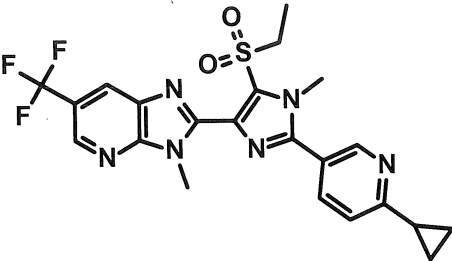
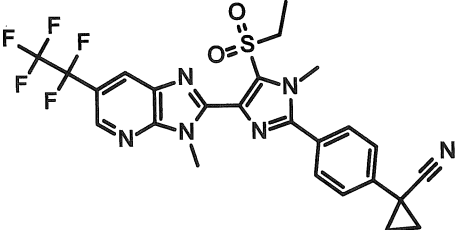
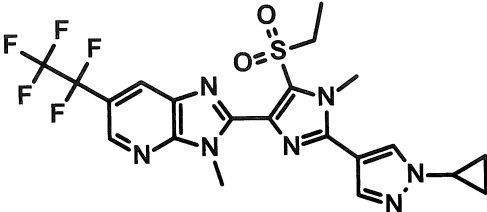
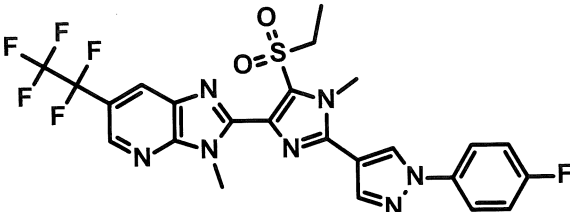
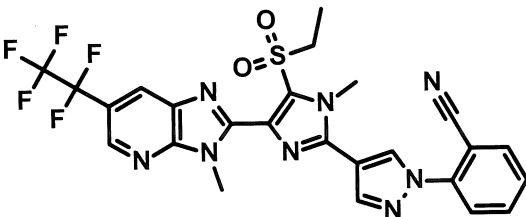
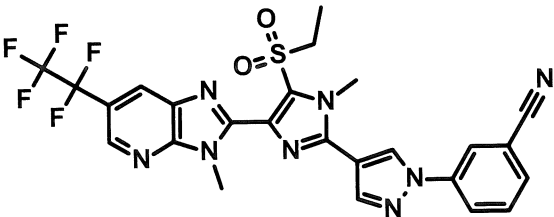
Dung dịch chứa 100 mg (0,221 mmol) 2-[2-bromo-5-(ethylsulfonyl)-1-metyl-1H-imidazol-4-yl]-3-metyl-6-(triflometyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin, 167 mg (1,25 mmol) *N*-closuxinimit và 30,6 mg (0,221 mmol) kali cacbonat được khuấy ở nhiệt độ 95°C trong 18 giờ. Hỗn hợp này được cô đặc. Phần còn lại được tinh chế trên RP18 bằng phương pháp HPLC sử dụng pha động axetonitril/nước. Phần còn lại được tinh chế trên RP18 bằng phương pháp HPLC sử dụng pha động là axetonitril/nước + 0,1% axit formic.

logP[axit]: 3,46; logP[trung tính]: 3,36; MH^+ : 480; 1H -NMR (400 MHz, d_6 -DMSO) δ ppm: 0,81 (m, 2H), 0,995 (m, 2H), 1,31 (t, 3H), 2,04 (m, 1H), 3,80 (q, 2H), 3,89 (s, 3H), 4,03 (s, 3H), 6,40 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 8,63 (m, 1H), 8,85 (m, 1H).

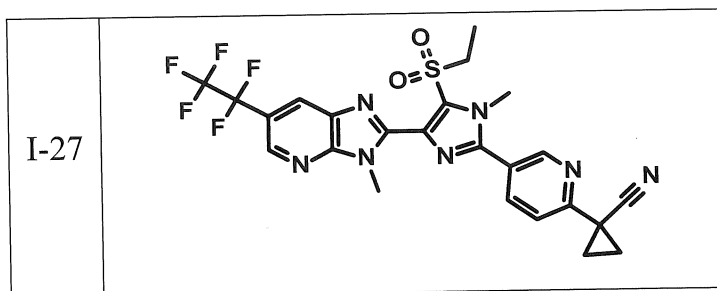
Tương tự các ví dụ và theo các quy trình điều chế đã được mô tả trên đây, có thể thu được các hợp chất có công thức (I) sau đây:

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

I-6	
I-7	
I-8	
I-9	
I-10	
I-11	
I-12	

I-13	
I-14	
I-15	
I-16	
I-17	
I-18	
I-19	

I-20	
I-21	
I-22	
I-23	
I-24	
I-25	
I-26	



Các trị số logP được xác định theo EEC Directive 79/831 Annex V.A8 bằng phương pháp sắc ký lỏng hiệu năng cao (HPLC: high-performance liquid chromatography) trên cột pha đảo (C18) bằng cách sử dụng các phương pháp sau:

[a] Trị số logP được xác định bằng phép đo LC-UV trong khoảng axit bằng cách sử dụng 0,9 ml/l axit formic trong nước và 1,0 ml/l axit formic trong axetonitril làm pha động (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

[b] Trị số logP được xác định bằng phép đo LC-UV trong khoảng trung tính bằng cách sử dụng 79 mg/l amoni cacbonat trong nước và axetonitril làm pha động (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

Việc hiệu chỉnh tiến hành bằng cách sử dụng dãy đồng đẳng của alkan-2-on mạch thẳng (có 3 đến 16 nguyên tử cacbon) với trị số logP đã biết. Các trị số giữa các alkanon liên tiếp được xác định bằng phép hồi quy tuyến tính.

Việc xác định $[M+H]^+$ hoặc M^- bằng LC-MS trong điều kiện sắc ký axit được tiến hành bằng cách sử dụng 1 ml axit formic trên mỗi lít axetonitril và 0,9 ml axit formic trên mỗi lít nước Millipore làm pha động. Cột Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm * 2,1 mm, 1,8 μ m được sử dụng ở nhiệt độ lò cột là 55°C.

Thiết bị:

LC-MS3: Waters UPLC với máy phổ khối SQD2 và thiết bị chuyển mẫu SampleManager. Gradient tuyến tính từ 0,0 đến 1,70 phút từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril, từ 1,70 đến 2,40 phút 95% axetonitril không đổi, lưu lượng 0,85 ml/phút.

LC-MS6 và LC-MS7: Agilent 1290 LC, máy phổ khối Agilent MSD, thiết bị chuyển mẫu HTS PAL. Gradient tuyến tính từ 0,0 đến 1,80 phút từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril, từ 1,80 đến 2,50 phút 95% axetonitril không đổi, lưu lượng 1,0 ml/phút.

Việc xác định $[M+H]^+$ bằng LC-MS trong điều kiện sắc ký trung tính được tiến hành bằng cách sử dụng axetonitril và nước Millipore với 79 mg/l amoni cacbonat làm pha động.

Thiết bị:

LC-MS4: Waters IClass Acquity với máy phổ khối QDA và thiết bị chuyển mẫu FTN (cột Waters Acquity 1,7 μ m 50 mm * 2,1 mm, nhiệt độ lò cột 45°C). Gradient tuyến tính từ 0,0 đến 2,10 phút từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril, từ 2,10 đến 3,00 phút 95% axetonitril không đổi, lưu lượng 0,7 ml/phút.

LC-MS5: Hệ Agilent 1100 LC với máy phổ khối MSD và thiết bị chuyển mẫu HTS PAL (cột: Zorbax XDB C18 1,8 μ m 50 mm * 4,6 mm, nhiệt độ lò cột 55°C). Gradient tuyến tính từ 0,0 đến 4,25 phút từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril, từ 4,25 đến 5,80 phút 95% axetonitril không đổi, lưu lượng 2,0 ml/phút.

Trong tất cả các trường hợp, chỉ số thời gian lưu được xác định từ cách đo hiệu chỉnh dãy đồng đẳng các alkan-2-on mạch thẳng có 3 đến 16 nguyên tử cacbon, trong đó chỉ số của alkanon thứ nhất được đặt là 300, chỉ số của alkanon cuối cùng được đặt là 1600 và phép nội suy tuyến tính được tiến hành giữa các trị của các alkanon liên tiếp.

Phổ ^1H NMR được đo bằng máy phổ kế Bruker Avance III 400 MHz được lắp với đầu lấy mẫu 1,7 mm TCI bằng cách sử dụng tetrametylsilan làm chất nội chuẩn (0,00 ppm), của các dung dịch trong dung môi CD_3CN , CDCl_3 hoặc $d_6\text{-DMSO}$. Theo cách khác, máy phổ kế Bruker Avance III 600 MHz được lắp với đầu lấy mẫu 5 mm CPNMP hoặc máy phổ kế Bruker Avance NEO 600 MHz được lắp với đầu lấy mẫu 5 mm TCI được sử dụng để đo. Nói chung, việc đo được tiến hành với nhiệt độ đầu lấy mẫu là 298°K (45°C). Nếu các nhiệt độ đo khác được sử dụng, nó sẽ được đề cập cụ thể.

Dữ liệu NMR của các ví dụ lựa chọn được liệt kê dưới dạng thông thường (trị số δ , tách đa bội, số nguyên tử hydro) hoặc dưới dạng các danh sách đỉnh NMR.

Trong mỗi trường hợp, dung môi trong đó phổ NMR được ghi được nêu rõ.

Dữ liệu NMR của các ví dụ lựa chọn

Phương pháp danh sách đỉnh NMR

Dữ liệu ^1H NMR của các ví dụ đã chọn được đưa ra dưới dạng danh sách đỉnh ^1H NMR. Đối với mỗi đỉnh tín hiệu, giá trị δ thứ nhất tính theo ppm và sau đó là cường độ tín hiệu trong dấu ngoặc tròn được liệt kê. Giá trị δ – các cặp số cường độ tín hiệu của các đỉnh tín hiệu khác nhau được liệt kê phân tách nhau bằng dấu chấm phẩy.

Do đó, danh sách đỉnh của một ví dụ có dạng:

δ_1 (cường độ₁); δ_2 (cường độ₂);; δ_i (cường độ_i);; δ_n (cường độ_n)

Cường độ của các tín hiệu rõ nét tương ứng với độ cao của các tín hiệu trong ví dụ đại diện được in ra của phổ ^1H NMR tính bằng cm và thể hiện các tỷ lệ thực của các cường độ tín hiệu. Trong trường hợp tín hiệu rộng, một số đỉnh hoặc giá trị trung bình của cường độ tín hiệu và cường độ tương đối của nó có thể được thể hiện trong phép so sánh với tín hiệu cường độ mạnh nhất trong phổ.

Việc hiệu chỉnh độ chuyển dịch hóa học của phổ ^1H NMR được thực hiện bằng cách sử dụng tetrametylsilan hoặc độ chuyển dịch hóa học của dung môi nếu mẫu này không chứa tetrametylsilan. Do đó, trong một số trường hợp danh mục đỉnh ^1H NMR có thể bao gồm đỉnh tetrametylsilan.

Danh sách các đỉnh ^1H NMR là tương tự như dữ liệu ^1H NMR được in ra thông thường và do đó thường chứa tất cả các đỉnh được liệt kê trong diễn giải ^1H NMR thông thường.

Ngoài ra, giống như các bản in ^1H NMR thông thường, danh sách đỉnh có thể thể hiện các tín hiệu của dung môi, các tín hiệu của chất đồng phân lập thể của các hợp chất theo sáng chế mà tùy ý được đề xuất bởi sáng chế, và/hoặc các đỉnh của tạp chất.

Các tín hiệu dung môi NMR, đỉnh tetrametylsilan và tín hiệu nước ở dung môi quan tâm được loại trừ ra khỏi quá trình hiệu chỉnh cường độ tương đối do trị số cường độ được nêu của chúng có thể rất cao.

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

Các chất đồng phân lập thể và/hoặc tạp chất như vậy có thể là đặc trưng trong quy trình điều chế cụ thể. Do đó, trong trường hợp này, các đỉnh có thể giúp để nhận

diện sự mô phỏng sao chép quy trình điều chế của tác giả sáng chế bằng việc tham chiếu "các dấu ấn sản phẩm phụ".

Chuyên gia tính toán đỉnh của các hợp chất theo sáng chế bằng các phương pháp đã biết (MestreC, mô phỏng ACD, và cả bằng các giá trị kỳ vọng đánh giá theo kinh nghiệm), nếu cần có thể xác định đỉnh của các hợp chất theo sáng chế, tùy ý sử dụng các bộ lọc cường độ bổ sung. Sự nhận diện này có thể sẽ tương tự như việc liệt kê đỉnh thích hợp trong cách diễn giải ^1H NMR thông thường.

Trong hồ sơ JCAMP, dung môi được sử dụng, việc đo tần số của quang phổ kế và kiểu quang phổ kế có thể được tìm thấy bằng cách sử dụng lần lượt thông số "dung môi", "tần số quan sát" và "hệ thống quang phổ kế/dữ liệu".

Dữ liệu ^{13}C NMR được nêu tương tự với dữ liệu ^1H NMR dưới dạng danh sách đỉnh bằng cách sử dụng phổ ^{13}C NMR khử liên hợp dải rộng. Tương tự, ở đây tín hiệu dung môi NMR và tetrametylsilan được loại trừ ra khỏi quá trình hiệu chỉnh cường độ tương đối do các tín hiệu này có trị số cường độ rất cao.

Các chi tiết cụ thể về danh mục đỉnh ^1H NMR có thể tìm thấy trong: "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" trong Research Disclosure Database Number 564025.

I-2: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8203 (2,6); 8,8171 (2,7); 8,5802 (2,7); 8,5763 (2,7); 7,7928 (4,0); 7,7714 (5,0); 7,5621 (5,0); 7,5406 (4,2); 6,2402 (1,1); 6,2234 (1,3); 6,2128 (1,3); 6,1959 (1,2); 4,2762 (1,0); 4,2594 (1,0); 4,2332 (1,2); 4,2166 (1,2); 4,0561 (14,1); 4,0381 (1,1); 4,0202 (0,9); 4,0023 (0,3); 3,9433 (1,1); 3,9158 (1,4); 3,9005 (1,0); 3,8732 (0,9); 3,8042 (16,0); 3,7792 (2,2); 3,7749 (2,2); 3,7573 (0,8); 3,3194 (114,5); 2,6749 (1,1); 2,6707 (1,4); 2,6663 (1,1); 2,5060 (178,0); 2,5017 (229,6); 2,4973 (181,7); 2,3329 (1,2); 2,3286 (1,6); 2,3243 (1,3); 1,9886 (3,5); 1,2979 (3,7); 1,2795 (7,9); 1,2611 (3,7); 1,2364 (0,4); 1,1929 (1,0); 1,1751 (1,9); 1,1574 (1,1); 1,0687 (0,4); -0,0002 (3,5)

I-3: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8170 (1,9); 8,8135 (1,9); 8,6853 (1,0); 8,6826 (1,2); 8,6787 (1,0); 8,6731 (1,0); 8,6706 (1,3); 8,6691 (1,2); 8,6665 (1,0); 8,5768 (2,0); 8,5724 (2,0); 7,9712 (0,6); 7,9684 (1,0); 7,9656 (0,7); 7,9513 (1,4); 7,9486 (2,2); 7,9458 (1,3); 7,9238 (1,1); 7,9195 (1,1); 7,9053 (1,4); 7,9009 (1,3); 7,8855 (0,7); 7,8812 (0,6); 7,5108 (0,9); 7,5074 (1,0); 7,4986 (0,9); 7,4952 (1,0); 7,4925 (1,0); 7,4891 (0,9); 7,4802 (0,8); 7,4768 (0,8); 6,2751 (1,0); 6,2584 (1,2); 6,2474 (1,2); 6,2305 (1,0); 4,3573 (0,9); 4,3404 (0,9); 4,3132 (1,1); 4,2965 (1,0); 4,0693 (13,1); 3,9632 (1,0); 3,9352 (1,2); 3,9191 (1,0); 3,8913 (0,8); 3,8142 (0,8); 3,7995 (16,0); 3,7777 (2,3); 3,7592 (0,8); 3,3224 (42,3); 2,6764 (0,4); 2,6718 (0,5); 2,6672 (0,4); 2,5252 (1,8); 2,5204 (2,9); 2,5119 (29,9); 2,5074 (58,5); 2,5028 (76,4); 2,4982 (56,1); 2,4937 (27,5); 2,3343 (0,3); 2,3296 (0,5); 2,3252 (0,3); 2,0749 (5,9); 1,3006 (3,2); 1,2821 (7,4); 1,2637 (3,1); -0,0002 (0,7)

I-4: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,9502 (2,2); 8,9462 (2,2); 8,8204 (2,1); 8,8170 (2,1); 8,6820 (1,6); 8,6780 (1,7); 8,6700 (1,7); 8,6660 (1,7); 8,5820 (2,2); 8,5775 (2,2); 8,1740 (0,9); 8,1693 (1,3); 8,1643 (0,9); 8,1540 (1,1); 8,1492 (1,4); 8,1443 (0,9); 7,5326 (1,1); 7,5222 (1,1); 7,5206 (1,1); 7,5141 (1,1); 7,5022 (1,0); 7,5006 (1,0); 6,2717 (1,0); 6,2548 (1,2); 6,2442 (1,2); 6,2271 (1,1); 4,3316 (0,9); 4,3145 (0,9); 4,2885 (1,1); 4,2716 (1,1); 4,0662 (13,7); 3,9928 (1,0); 3,9650 (1,2); 3,9497 (1,0); 3,9222 (0,8); 3,8227 (1,0); 3,8106 (16,0); 3,7999 (2,0); 3,7861 (1,8); 3,7815 (1,8); 3,7636 (0,7); 3,3212 (74,0); 2,6756 (0,8); 2,6710 (1,0); 2,6666 (0,8); 2,6621 (0,4); 2,5244 (3,6); 2,5196 (5,8); 2,5111 (62,3); 2,5066 (121,8); 2,5020 (158,7); 2,4975 (116,5); 2,4930 (58,1); 2,3380 (0,4); 2,3334 (0,8); 2,3289 (1,0);

2,3244 (0,8); 1,3020 (3,4); 1,2836 (7,7); 1,2651 (3,3); 0,0079 (2,8); -0,0002 (73,2); -0,0085 (2,7)

I-6: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8406 (2,0); 8,8371 (2,0); 8,6042 (2,1); 8,6001 (2,0); 8,4768 (4,2); 8,3153 (0,6); 8,0015 (4,2); 8,0002 (4,2); 4,0224 (14,0); 3,8960 (0,4); 3,8865 (0,8); 3,8732 (16,0); 3,8590 (1,1); 3,8499 (0,7); 3,8403 (0,4); 3,7681 (0,9); 3,7495 (3,1); 3,7311 (3,1); 3,7126 (0,9); 3,3217 (77,4); 2,6795 (0,6); 2,6750 (1,3); 2,6705 (1,8); 2,6659 (1,3); 2,6612 (0,6); 2,5645 (1,0); 2,5239 (5,8); 2,5192 (8,5); 2,5105 (106,4); 2,5061 (213,9); 2,5015 (278,8); 2,4969 (198,4); 2,4924 (94,1); 2,3375 (0,6); 2,3329 (1,3); 2,3283 (1,7); 2,3238 (1,2); 2,3194 (0,6); 1,9885 (0,4); 1,3040 (3,4); 1,2856 (7,8); 1,2671 (3,2); 1,1695 (0,5); 1,1568 (1,3); 1,1545 (1,3); 1,1481 (2,2); 1,1401 (2,2); 1,1299 (0,8); 1,0995 (0,4); 1,0605 (0,8); 1,0483 (1,6); 1,0424 (1,9); 1,0297 (1,9); 1,0260 (1,3); 1,0238 (1,3); 1,0100 (0,5); 0,1459 (0,8); 0,0080 (6,5); -0,0002 (204,2); -0,0085 (6,5); -0,1497 (0,8)

I-7: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 10,2045 (0,6); 8,8555 (2,8); 8,6313 (2,8); 8,6271 (2,8); 7,6490 (3,3); 7,6443 (3,5); 6,8814 (3,4); 6,8767 (3,5); 5,7569 (6,6); 4,0179 (0,4); 4,0083 (0,7); 3,9993 (1,1); 3,9902 (1,5); 3,9808 (1,1); 3,9719 (0,9); 3,9629 (0,7); 3,9433 (14,6); 3,9293 (16,0); 3,8999 (1,3); 3,8820 (3,5); 3,8635 (3,6); 3,8450 (1,2); 3,3269 (144,2); 2,6710 (1,0); 2,5056 (119,2); 2,5021 (152,4); 2,3290 (1,0); 1,3569 (3,7); 1,3385 (7,9); 1,3201 (3,6); 1,0769 (0,6); 1,0638 (1,9); 1,0562 (3,0); 1,0478 (2,8); 1,0373 (0,9); 0,9571 (0,9); 0,9456 (2,0); 0,9393 (2,6); 0,9272 (2,4); 0,9223 (2,0); 0,9082 (0,6); 0,1458 (0,4); -0,0003 (72,6); -0,1501 (0,4)

I-8: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8442 (3,2); 8,6094 (3,2); 7,5732 (3,1); 7,5637 (3,2); 7,0012 (3,0); 6,9917 (3,0); 4,0812 (14,8); 3,8691 (16,0); 3,7818 (1,2); 3,7636 (3,6); 3,7451 (3,7); 3,7270 (1,2); 3,3270 (128,5); 2,6717 (1,0); 2,5061 (134,1); 2,5024 (172,5); 2,4987 (143,8); 2,3289 (1,0); 2,2680 (0,4); 2,2559 (0,7); 2,2470 (0,8); 2,2351 (1,4); 2,2229 (0,9); 2,2145 (0,8); 2,2018 (0,4); 1,3110 (3,9); 1,2926 (8,2); 1,2742 (3,8); 1,1122 (0,9); 1,1013 (2,4); 1,0957 (2,9); 1,0806 (2,6); 1,0752 (2,8); 1,0649 (1,0); 0,7952 (1,0); 0,7842 (3,1); 0,7798 (3,2); 0,7728 (2,9); 0,7677 (3,4); 0,7564 (0,9); 0,1461 (0,4); -0,0004 (72,8); -0,1497 (0,4)

I-10: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8584 (2,4); 8,8539 (2,4); 8,6343 (2,5); 8,6298 (2,4); 8,5855 (6,3); 8,3149 (0,4); 5,7553 (0,8); 3,9505 (14,7); 3,8928 (16,0); 3,8522 (1,0); 3,8337 (3,3); 3,8152 (3,4); 3,7968 (1,0); 3,3225 (137,3); 2,6749 (0,8); 2,6703 (1,1); 2,6661 (0,8); 2,5235 (3,0); 2,5098 (65,9); 2,5059 (129,2); 2,5015 (169,0); 2,4971 (124,0); 2,3327 (0,8); 2,3283 (1,0); 2,3240 (0,8); 2,0036 (0,6); 1,9952 (0,7); 1,9830 (1,3); 1,9706 (0,8); 1,9623 (0,7); 1,9497 (0,3); 1,3335 (3,7); 1,3151 (8,1); 1,2966 (3,6); 1,0651 (0,6); 1,0543 (1,7); 1,0479 (2,2); 1,0388 (1,2); 1,0336 (1,6); 1,0272 (2,0); 1,0186 (0,8); 0,9420 (0,9); 0,9331 (2,2); 0,9274 (2,2); 0,9211 (2,3); 0,9151 (2,1); 0,9037 (0,6); 0,1455 (0,3); 0,0072 (2,7); - 0,0003 (70,7); -0,0008 (70,7); -0,0083 (3,1); -0,1498 (0,4)

I-11: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8579 (1,1); 8,8546 (1,1); 8,6268 (1,2); 8,6230 (1,1); 7,8131 (1,2); 7,8032 (1,5); 7,7826 (1,4); 7,7640 (1,6); 7,7198 (1,4); 7,7099 (1,2); 7,4935 (0,7); 7,4752 (1,6); 7,4556 (1,0); 7,4074 (0,6); 7,3889 (0,8); 4,1619 (6,3); 4,0570 (1,3); 4,0392 (4,0); 4,0214 (4,0); 4,0036 (1,4); 3,9048 (6,9); 3,8111 (0,4); 3,7927 (1,5); 3,7743 (1,5); 3,7559 (0,5); 3,5871 (0,5); 3,5813 (0,3); 3,5693 (0,5); 3,3275 (12,5); 2,5083 (10,6); 2,5039 (13,7); 2,4996 (10,3); 1,9901 (16,0); 1,3363 (1,7); 1,3179 (3,6); 1,2995 (1,6); 1,1938 (4,4); 1,1760 (8,7); 1,1582 (4,3); 0,0078 (0,4); -0,0002 (8,9); -0,0083 (0,4)

I-12: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8514 (2,3); 8,8469 (2,3); 8,6230 (2,4); 8,6189 (2,3); 8,3153 (1,2); 7,7710 (1,3); 7,7523 (1,7); 7,7215 (2,6); 7,6507 (1,0); 7,6314 (2,3); 7,6126 (1,6); 7,5936 (2,0); 7,5736 (0,8); 3,9639 (0,8); 3,9506 (13,8); 3,9029 (16,0); 3,8468 (1,0); 3,8284 (3,2); 3,8099 (3,2); 3,7915 (1,0); 3,3261 (799,2); 2,6753 (2,9); 2,6707 (4,0); 2,6662 (2,9); 2,6003 (0,4); 2,5241 (11,2); 2,5106 (243,5); 2,5063 (492,3); 2,5019 (647,4); 2,4974 (463,6); 2,4930 (223,2); 2,3330 (2,7); 2,3287 (3,9); 2,3241 (2,8); 1,8444 (1,1); 1,8312 (3,2); 1,8242 (3,5); 1,8127 (1,4); 1,6466 (1,5); 1,6345 (3,3); 1,6274 (3,5); 1,6139 (1,1); 1,3519 (3,5); 1,3336 (7,8); 1,3151 (3,4); 1,2332 (0,4); 0,1463 (0,4); 0,0079 (3,2); -0,0002 (95,6); -0,0084 (3,4); -0,1496 (0,4)

I-13: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8577 (2,1); 8,8542 (2,2); 8,6263 (2,2); 8,6222 (2,2); 7,7558 (3,3); 7,7459 (3,5); 7,6292 (1,9); 7,6264 (2,0); 7,6165 (2,0); 7,6137 (2,0); 7,4902 (4,9); 7,4802 (5,1); 7,1616 (2,1); 7,1525 (2,0); 7,1490 (2,0); 7,1398 (1,9); 5,7558 (2,2); 4,1468 (14,4); 3,8949

(16,0); 3,8019 (0,9); 3,7834 (3,2); 3,7649 (3,2); 3,7465 (1,0); 3,3240 (148,1); 2,6755 (0,6); 2,6709 (0,9); 2,6665 (0,7); 2,5245 (2,7); 2,5197 (4,0); 2,5110 (51,5); 2,5066 (105,2); 2,5020 (139,6); 2,4974 (101,8); 2,4929 (49,7); 2,3334 (0,7); 2,3288 (0,9); 2,3243 (0,6); 1,3293 (3,5); 1,3109 (8,1); 1,2925 (3,5); -0,0002 (4,8)

I-14: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8489 (0,7); 8,8453 (0,7); 8,8184 (0,7); 8,8131 (0,7); 8,6188 (0,7); 8,6147 (0,7); 8,1020 (0,5); 8,0962 (0,5); 8,0816 (0,5); 8,0759 (0,5); 7,5414 (0,7); 7,5209 (0,6); 3,9687 (4,4); 3,9298 (2,4); 3,9097 (4,9); 3,8381 (1,0); 3,8196 (1,0); 3,5858 (0,4); 3,5800 (0,3); 3,3257 (24,3); 2,5245 (0,7); 2,5112 (10,7); 2,5070 (20,8); 2,5025 (26,9); 2,4979 (19,6); 2,4936 (9,7); 2,2354 (0,4); 1,3493 (1,1); 1,3309 (2,4); 1,3124 (1,1); 1,2343 (0,6); 1,0914 (0,4); 1,0691 (16,0); 1,0485 (0,4); 1,0415 (1,1); 1,0359 (1,1); 1,0280 (0,8); 1,0232 (0,9); 1,0165 (0,4); 0,0078 (0,7); -0,0002 (16,2); -0,0084 (0,6)

I-15: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7799 (2,3); 8,7751 (2,4); 8,5716 (2,4); 8,5669 (2,3); 7,8567 (3,8); 7,8520 (1,4); 7,8402 (1,4); 7,8354 (4,6); 7,8303 (0,7); 7,5568 (4,4); 7,5520 (1,4); 7,5401 (1,3); 7,5354 (3,9); 5,7563 (1,8); 3,9669 (14,3); 3,9281 (0,6); 3,9190 (16,0); 3,8655 (0,9); 3,8471 (3,1); 3,8286 (3,2); 3,8101 (0,9); 3,3263 (47,6); 2,5255 (0,9); 2,5208 (1,3); 2,5121 (17,1); 2,5077 (35,1); 2,5031 (46,5); 2,4985 (33,6); 2,4939 (16,2); 1,8795 (1,1); 1,8666 (3,0); 1,8594 (3,4); 1,8481 (1,4); 1,6604 (1,3); 1,6479 (3,2); 1,6408 (3,3); 1,6271 (1,0); 1,3529 (3,5); 1,3345 (8,1); 1,3160 (3,4); -0,0002 (1,8)

I-16: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7728 (2,1); 8,7680 (2,2); 8,5585 (2,2); 8,5538 (2,2); 8,4753 (4,3); 8,3150 (0,4); 7,9996 (4,3); 7,9983 (4,3); 4,0230 (14,2); 3,8976 (0,5); 3,8857 (16,0); 3,8701 (1,5); 3,8606 (1,1); 3,8516 (0,7); 3,8419 (0,4); 3,7788 (0,9); 3,7604 (3,0); 3,7419 (3,1); 3,7235 (0,9); 3,3238 (229,8); 2,6797 (0,4); 2,6753 (1,0); 2,6707 (1,4); 2,6661 (1,0); 2,6618 (0,4); 2,5242 (3,7); 2,5194 (5,6); 2,5108 (78,3); 2,5063 (160,1); 2,5017 (212,3); 2,4972 (154,0); 2,4926 (74,8); 2,3377 (0,5); 2,3331 (1,0); 2,3286 (1,4); 2,3240 (1,0); 2,3195 (0,5); 1,3070 (3,5); 1,2886 (8,0); 1,2702 (3,4); 1,2345 (0,4); 1,1696 (0,7); 1,1591 (1,4); 1,1568 (1,4); 1,1548 (1,5); 1,1483 (2,5); 1,1403 (2,4); 1,1301 (1,0); 1,0999 (0,6); 1,0897 (0,4); 1,0821 (0,4); 1,0613 (1,0); 1,0491 (1,8); 1,0431 (2,1); 1,0304 (2,1); 1,0266 (1,6); 1,0247 (1,5); 1,0108 (0,6); -0,0003 (7,7)

I-17: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,1379 (4,9); 8,7903 (1,3); 8,7845 (2,3); 8,7799 (2,4); 8,5759 (2,4); 8,5713 (2,4); 8,3354 (5,2); 8,3153 (0,4); 8,0499 (1,2); 8,0353 (2,1); 8,0298 (0,8); 8,0234 (2,2); 8,0180 (1,3); 8,0124 (2,4); 8,0063 (0,8); 8,0006 (2,2); 7,8876 (0,5); 7,8758 (0,5); 7,8646 (0,5); 7,8529 (0,5); 7,4519 (2,3); 7,4463 (0,7); 7,4399 (0,4); 7,4298 (3,7); 7,4201 (0,3); 7,4134 (0,7); 7,4077 (2,7); 7,3852 (0,9); 7,3632 (0,5); 5,7557 (3,2); 4,1185 (14,4); 3,9196 (16,0); 3,8128 (0,9); 3,7943 (3,2); 3,7758 (3,3); 3,7574 (1,0); 3,3245 (187,5); 2,6756 (0,8); 2,6710 (1,1); 2,6666 (0,8); 2,6619 (0,4); 2,5245 (3,5); 2,5197 (5,2); 2,5110 (61,8); 2,5066 (124,0); 2,5021 (162,7); 2,4975 (117,2); 2,4930 (56,0); 2,3334 (0,7); 2,3289 (1,0); 2,3243 (0,7); 1,3321 (3,6); 1,3137 (8,2); 1,2953 (3,5); 1,2346 (1,2); 1,1587 (0,5); 1,0687 (0,6); -0,0002 (5,7)

I-18: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,0982 (4,9); 9,0969 (4,9); 8,7860 (2,2); 8,7813 (2,2); 8,5790 (2,3); 8,5742 (2,1); 8,4501 (4,9); 8,4489 (4,8); 8,3143 (0,6); 8,1622 (2,5); 8,1083 (1,5); 8,1069 (1,5); 8,0893 (1,6); 8,0868 (1,5); 7,9834 (0,4); 7,9798 (0,7); 7,9629 (2,3); 7,9590 (3,5); 7,9419 (1,5); 7,9384 (1,5); 7,9214 (0,5); 7,9178 (0,5); 7,7040 (1,1); 7,6992 (1,1); 7,6868 (1,0); 7,6845 (1,2); 7,6823 (1,2); 7,6802 (1,1); 7,6672 (0,8); 7,6628 (0,8); 5,7549 (3,2); 4,1168 (14,1); 3,9216 (16,0); 3,8213 (0,9); 3,8030 (3,1); 3,7845 (3,2); 3,7661 (1,0); 3,4734 (0,4); 3,4613 (0,4); 3,3312 (172,6); 2,6803 (0,6); 2,6758 (1,2); 2,6713 (1,6); 2,6667 (1,2); 2,6620 (0,6); 2,5416 (0,7); 2,5248 (4,5); 2,5200 (6,6); 2,5113 (91,3); 2,5068 (188,7); 2,5023 (249,9); 2,4977 (178,1); 2,4931 (83,7); 2,3382 (0,5); 2,3337 (1,1); 2,3291 (1,6); 2,3245 (1,1); 2,3201 (0,5); 1,3356 (3,4); 1,3172 (8,0); 1,2988 (3,6); 1,2350 (1,6); 0,8541 (0,4); -0,0003 (3,3)

I-19: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 9,2917 (4,7); 8,9826 (0,5); 8,7875 (2,2); 8,7825 (2,2); 8,5802 (2,3); 8,5755 (2,2); 8,5249 (1,5); 8,5209 (2,2); 8,4122 (5,3); 8,3592 (1,1); 8,3564 (1,0); 8,3537 (1,0); 8,3410 (1,0); 8,3385 (1,1); 8,3354 (1,0); 8,3150 (1,6); 8,1284 (0,5); 7,8837 (1,3); 7,8646 (2,0); 7,8103 (1,8); 7,7902 (2,7); 7,7702 (1,1); 7,5702 (0,3); 7,5520 (0,5); 7,5259 (0,4); 4,4990 (0,4); 4,4943 (0,4); 4,2174 (0,4); 4,2123 (0,4); 4,1370 (13,9); 3,9268 (16,0); 3,8228 (0,9); 3,8044 (3,1); 3,7859 (3,2); 3,7675 (0,9); 3,4193 (0,4); 3,4086 (0,4); 3,3251 (836,3); 2,6796 (1,5); 2,6752 (3,1); 2,6707 (4,3); 2,6663 (3,2); 2,6617 (1,5); 2,5840

(0,3); 2,5242 (11,8); 2,5193 (17,6); 2,5107 (254,7); 2,5063 (521,6); 2,5018 (688,6);
2,4972 (491,8); 2,4927 (234,0); 2,4219 (0,3); 2,3376 (1,4); 2,3330 (3,0); 2,3286 (4,3);
2,3240 (3,1); 2,3196 (1,4); 2,0740 (3,9); 1,3377 (3,5); 1,3193 (8,0); 1,3008 (3,7); 1,2964
(2,6); 1,0685 (0,3); 0,9195 (0,5); -0,0003 (2,0)

I-20: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 9,3120 (4,5); 9,1687 (2,3); 8,7879 (2,3); 8,7833 (2,4); 8,6507 (2,8); 8,6445 (2,9);
8,5810 (2,4); 8,5767 (2,4); 8,4516 (5,3); 8,4343 (0,8); 8,4286 (1,3); 8,4227 (0,7); 8,4091
(0,8); 8,4033 (1,3); 8,3973 (0,7); 8,3155 (0,8); 5,3934 (0,7); 5,3239 (0,4); 4,1315 (14,1);
3,9227 (16,0); 3,8209 (0,9); 3,8027 (3,1); 3,7843 (3,2); 3,7657 (1,0); 3,3239 (223,3);
2,6753 (1,8); 2,6709 (2,6); 2,6663 (1,9); 2,5242 (6,3); 2,5107 (153,7); 2,5063 (315,5);
2,5019 (419,0); 2,4974 (308,1); 2,4931 (153,9); 2,3376 (1,0); 2,3331 (1,9); 2,3287 (2,6);
2,3242 (2,0); 2,1781 (0,4); 2,0265 (0,4); 2,0079 (0,8); 1,9888 (1,0); 1,9739 (0,4); 1,9627
(0,3); 1,5512 (0,7); 1,4743 (0,4); 1,4589 (0,4); 1,3361 (3,8); 1,3178 (8,2); 1,2991 (4,8);
1,2586 (3,0); 1,2354 (10,7); 1,1927 (0,3); 1,1751 (0,3); 1,1558 (1,5); 1,1389 (1,4);
0,8700 (0,7); 0,8539 (2,0); 0,8360 (0,9); 0,1459 (0,5); 0,0080 (3,7); -0,0001 (125,6); -
0,0083 (5,3); -0,1496 (0,6)

I-21: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,7874 (2,1); 8,7826 (2,2); 8,5834 (2,2); 8,5787 (2,1); 8,2562 (2,9); 8,2497 (3,0);
8,1426 (6,0); 6,4079 (3,4); 6,4013 (3,4); 5,7503 (1,8); 4,0268 (14,7); 3,8986 (16,0);
3,8335 (1,0); 3,8150 (3,2); 3,7965 (3,2); 3,7781 (1,1); 3,7198 (0,3); 3,7062 (0,3); 3,6719
(0,4); 3,3842 (230,4); 2,6794 (0,6); 2,6747 (0,8); 2,6703 (0,6); 2,5282 (2,2); 2,5233
(3,6); 2,5148 (47,3); 2,5103 (96,3); 2,5058 (126,1); 2,5012 (89,6); 2,4967 (42,4); 2,3372
(0,6); 2,3325 (0,8); 2,3281 (0,6); 2,0728 (0,5); 2,0652 (0,6); 2,0571 (0,7); 2,0446 (1,3);
2,0323 (0,7); 2,0237 (0,7); 2,0112 (0,3); 1,3341 (3,5); 1,3157 (8,0); 1,2972 (3,4); 1,0206
(0,8); 1,0100 (2,1); 1,0039 (2,4); 0,9998 (1,0); 0,9944 (1,2); 0,9890 (2,1); 0,9829 (2,2);
0,9735 (0,9); 0,8249 (1,0); 0,8153 (2,4); 0,8124 (1,7); 0,8093 (2,4); 0,8030 (2,4); 0,7970
(2,4); 0,7863 (0,7); 0,1460 (0,6); 0,0186 (0,3); 0,0079 (5,2); -0,0002 (147,4); -0,0085
(5,0); -0,1495 (0,6)

I-22: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8169 (2,1); 8,8112 (2,2); 8,7805 (2,2); 8,7758 (2,4); 8,5723 (2,3); 8,5675 (2,3);
8,3150 (0,5); 8,1007 (1,6); 8,0949 (1,6); 8,0803 (1,8); 8,0746 (1,8); 7,5422 (2,2); 7,5217

(2,0); 3,9684 (14,4); 3,9204 (16,0); 3,8651 (0,9); 3,8467 (3,1); 3,8282 (3,2); 3,8098 (0,9); 3,3241 (274,4); 2,6752 (1,1); 2,6708 (1,5); 2,6662 (1,1); 2,5243 (3,7); 2,5195 (5,8); 2,5108 (87,3); 2,5064 (180,1); 2,5018 (239,4); 2,4972 (173,2); 2,4927 (83,6); 2,3379 (0,6); 2,3332 (1,2); 2,3286 (1,6); 2,3241 (1,2); 2,2679 (0,4); 2,2552 (0,6); 2,2482 (0,7); 2,2357 (1,2); 2,2292 (0,6); 2,2233 (0,7); 2,2161 (0,7); 2,2036 (0,4); 1,3514 (3,6); 1,3330 (8,2); 1,3145 (3,5); 1,2342 (0,4); 1,0822 (0,4); 1,0689 (1,3); 1,0622 (2,8); 1,0567 (1,4); 1,0486 (1,2); 1,0417 (3,3); 1,0354 (3,1); 1,0276 (2,5); 1,0229 (2,9); 1,0161 (1,4); 1,0025 (0,3); -0,0002 (8,7)

I-23: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7834 (2,2); 8,7788 (2,3); 8,5753 (2,3); 8,5707 (2,2); 7,7958 (1,3); 7,7771 (1,7); 7,7744 (1,7); 7,7557 (1,6); 7,4727 (2,6); 7,4546 (2,3); 7,3084 (0,6); 7,0474 (2,0); 7,0259 (1,9); 4,3321 (13,9); 4,0382 (0,7); 4,0204 (0,7); 3,8992 (16,0); 3,8199 (0,9); 3,8014 (3,2); 3,7829 (3,3); 3,7659 (3,4); 3,7554 (4,2); 3,7424 (3,4); 3,5549 (3,4); 3,5423 (4,1); 3,5307 (2,6); 3,3264 (109,7); 2,6760 (0,4); 2,6715 (0,6); 2,6669 (0,5); 2,5249 (1,8); 2,5201 (2,8); 2,5115 (36,8); 2,5071 (75,5); 2,5025 (99,7); 2,4980 (71,3); 2,4935 (34,0); 2,3338 (0,4); 2,3293 (0,6); 2,3248 (0,4); 1,9892 (3,3); 1,3351 (0,3); 1,3245 (3,5); 1,3062 (8,1); 1,2877 (3,5); 1,2492 (0,6); 1,2347 (1,3); 1,1930 (0,9); 1,1752 (1,8); 1,1574 (0,9); 0,9639 (0,4); 0,9457 (0,7); 0,9279 (0,4); 0,8537 (0,4); 0,0080 (0,5); -0,0002 (15,4); -0,0084 (0,5)

I-24: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,7825 (2,4); 8,7780 (2,5); 8,5753 (2,5); 8,5709 (2,4); 7,9525 (0,6); 7,7708 (1,4); 7,7521 (1,8); 7,7488 (1,3); 7,7276 (1,8); 7,7234 (2,7); 7,6520 (1,0); 7,6324 (2,3); 7,6137 (1,6); 7,5968 (1,3); 7,5933 (1,9); 7,5892 (1,3); 7,5771 (0,7); 7,5728 (0,8); 4,0380 (0,5); 4,0203 (0,5); 3,9650 (0,6); 3,9522 (14,0); 3,9155 (16,0); 3,8573 (0,9); 3,8388 (3,1); 3,8203 (3,2); 3,8017 (1,0); 3,3287 (184,3); 2,8912 (4,3); 2,7316 (3,6); 2,6759 (0,5); 2,6715 (0,7); 2,6671 (0,5); 2,5247 (2,1); 2,5113 (43,2); 2,5070 (87,2); 2,5025 (114,6); 2,4980 (82,5); 2,4937 (40,0); 2,3339 (0,5); 2,3294 (0,7); 2,3248 (0,5); 1,9891 (2,0); 1,8456 (1,1); 1,8327 (3,3); 1,8255 (3,5); 1,8140 (1,4); 1,6466 (1,5); 1,6344 (3,4); 1,6273 (3,5); 1,6138 (1,0); 1,3560 (3,5); 1,3376 (8,0); 1,3191 (3,4); 1,1929 (0,6); 1,1752 (1,1); 1,1574 (0,6); 0,0079 (0,6); -0,0002 (15,8); -0,0084 (0,6)

I-25: ^1H -NMR(400,2 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8,8011 (2,4); 8,7963 (2,5); 8,6018 (2,5); 8,5976 (2,4); 8,3999 (3,5); 8,3943 (3,4); 8,3849 (0,3); 8,3156 (2,0); 8,0215 (0,4); 8,0152 (0,4); 7,8477 (1,9); 7,8427 (2,6); 7,8383 (1,8); 7,7337 (0,8); 7,7294 (0,9); 7,7147 (1,5); 7,7103 (1,5); 7,6953 (0,7); 7,6909 (0,9); 7,5805 (0,4); 7,5695 (0,4); 7,5646 (0,4); 7,5054 (0,4); 7,5003 (0,4); 7,4920 (0,6); 7,4873 (0,8); 7,4663 (1,1); 7,4613 (0,8); 7,4528 (0,7); 7,4485 (0,8); 7,4149 (1,2); 7,3880 (1,3); 7,3797 (1,4); 7,3670 (0,8); 7,3611 (1,8); 7,3424 (0,8); 7,3398 (0,8); 3,9450 (16,0); 3,9174 (1,0); 3,8987 (3,5); 3,8801 (3,6); 3,8703 (13,9); 3,4391 (0,4); 3,4324 (0,3); 3,4177 (0,4); 3,3240 (1010,3); 3,2813 (0,4); 2,6797 (2,6); 2,6753 (5,4); 2,6707 (7,2); 2,6662 (5,3); 2,6404 (0,4); 2,6196 (0,5); 2,5241 (21,1); 2,5193 (33,6); 2,5107 (424,6); 2,5063 (869,0); 2,5017 (1146,8); 2,4972 (822,2); 2,4927 (393,8); 2,4009 (0,3); 2,3374 (2,3); 2,3331 (4,9); 2,3286 (7,1); 2,3240 (5,2); 2,3196 (2,5); 1,3890 (3,7); 1,3704 (8,4); 1,3519 (3,6); 1,2352 (1,2); 0,1461 (0,8); 0,0079 (6,8); -0,0002 (219,7); -0,0085 (8,1); -0,0263 (0,5); -0,1500 (0,9)

I-26: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,8012 (2,3); 8,7967 (2,5); 8,6023 (2,4); 8,5979 (2,4); 8,3626 (3,3); 8,3568 (3,4); 7,9134 (3,2); 7,9077 (3,1); 7,7655 (2,0); 7,7603 (0,9); 7,7521 (2,2); 7,7434 (2,6); 7,7355 (1,0); 7,7300 (2,3); 7,3811 (2,2); 7,3759 (0,8); 7,3589 (4,2); 7,3419 (0,7); 7,3367 (2,0); 5,7560 (2,8); 3,9473 (16,0); 3,9237 (1,0); 3,9052 (3,3); 3,8900 (15,1); 3,8683 (1,0); 3,3246 (74,2); 2,6759 (0,5); 2,6713 (0,7); 2,6669 (0,5); 2,5248 (2,1); 2,5112 (44,0); 2,5069 (89,7); 2,5024 (117,9); 2,4979 (85,2); 2,4935 (41,7); 2,3336 (0,5); 2,3292 (0,7); 2,3246 (0,6); 2,0748 (0,3); 1,3877 (3,4); 1,3693 (7,8); 1,3508 (3,4); 0,1459 (0,4); 0,0079 (3,4); -0,0002 (98,0); -0,0085 (3,8); -0,1496 (0,4)

I-27: $^1\text{H-NMR}$ (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

δ = 8,9423 (2,1); 8,9403 (2,3); 8,9367 (2,3); 8,9347 (2,1); 8,7844 (2,1); 8,7798 (2,2); 8,5783 (2,2); 8,5735 (2,2); 8,3157 (2,4); 8,3110 (1,7); 8,3053 (1,5); 8,2903 (1,8); 8,2846 (1,9); 7,7767 (2,2); 7,7748 (2,1); 7,7561 (2,1); 7,7541 (2,0); 3,9811 (14,0); 3,9224 (16,0); 3,8754 (0,9); 3,8572 (3,0); 3,8388 (3,1); 3,8205 (0,9); 3,3248 (703,0); 2,6798 (1,6); 2,6754 (3,6); 2,6708 (5,0); 2,6662 (3,6); 2,6617 (1,7); 2,5244 (14,0); 2,5196 (20,8); 2,5109 (289,1); 2,5064 (597,2); 2,5018 (790,9); 2,4972 (565,6); 2,4927 (267,4); 2,3378 (1,6); 2,3332 (3,6); 2,3287 (4,9); 2,3241 (3,6); 2,3195 (1,6); 1,9437 (1,0); 1,9312 (2,4); 1,9225 (3,3); 1,9134 (1,4); 1,8277 (1,5); 1,8179 (3,2); 1,8093 (2,4); 1,7962 (0,9);

1,3585 (3,3); 1,3400 (7,8); 1,3216 (3,2); 0,1460 (4,1); 0,0322 (0,5); 0,0228 (0,8); 0,0080 (34,8); -0,0002 (1044,9); -0,0085 (33,9); -0,0172 (1,7); -0,0253 (0,9); -0,0354 (0,5); -0,1495 (4,2)

Ví dụ sử dụng

Boophilus microplus – Thử nghiệm tiêm

Dung môi: dimetyl sulfoxit

Để tạo ra dạng điều chế của hoạt chất thích hợp, 10 mg hoạt chất được trộn với 0,5 ml dung môi và dịch cô đặc được pha loãng đến nồng độ mong muốn bằng dung môi.

1 µl dung dịch hoạt chất được tiêm vào trong bụng của 5 con tích gia súc cái trưởng thành hút căng máu (*Boophilus microplus*). Động vật được chuyển vào trong các đĩa và giữ ở trong phòng được kiểm soát khí hậu.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 95% với tỷ lệ áp dụng là 20 µg/con: I-6.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng 20 µg/động vật: I-10.

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống

Dung môi: dimetyl sulfoxit

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

Khoảng 20 bộ chết mèo trưởng thành (*Ctenocephalides felis*) chưa được cho ăn được đặt vào khoang được đậy kín ở đỉnh và đáy bằng gạc. Một cột trụ bằng kim loại

mà đáy của nó được đậy kín bằng parafilm được đặt lên trên khoang này. Cột trụ này chứa máu/chế phẩm chứa hoạt chất, có thể được bộ chết hút qua màng parafilm.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ phun là 20ppm: I-1, I-5, I-6.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ phun là 100ppm: I-9, I-10, I-11, I-14.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 80% với tỷ lệ phun là 100ppm: I-8.

Diabrotica balteata – thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các hạt lúa mì đã làm trương nở trước (*Triticum aestivum*) được ủ trong đĩa nhiều lỗ chứa aga và một chút nước trong một ngày (5 hạt trong một lỗ). Các hạt lúa mì đã nảy mầm được phun chế phẩm chứa thành phần hoạt tính ở nồng độ mong muốn. Sau đó, từng khoang được nhiễm 10-20 ấu trùng bộ cánh cứng *Diabrotica balteata*.

Sau thời gian 7 ngày, hiệu quả tính theo % được xác định. 100% nghĩa là tất cả các cây lúa mì đều sinh trưởng như ở đối chứng không được xử lý, không bị nhiễm ấu trùng; 0% nghĩa là không có cây lúa mì nào sinh trưởng.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng là 160 µg/lỗ: I-12, I-15, I-16, I-17, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 80% với tỷ lệ áp dụng là 160 µg/lỗ: I-13, I-18.

Myzus persicae – thử nghiệm uống

Dung môi: 100 phần khối lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hoạt chất, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn.

50 µl chế phẩm chứa thành phần hoạt tính được chuyển vào các đĩa vi chuẩn độ và pha đến thể tích cuối 200 µl bằng 150 µl môi trường IPL41 dùng cho côn trùng (33% + 15% đường). Sau đó, các đĩa được đậy bằng parafilm, mà qua đó quần thể hỗn hợp rệp đào xanh (*Myzus persicae*) trong đĩa vi chuẩn độ thứ hai có thể đục thủng và hút dung dịch.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ phun là 4 ppm: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26.

Myzus persicae – thử nghiệm phun

Dung môi: 78 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-1, I-4, I-5, I-6, I-8, I-9, I-20.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-3, I-7, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-21, I-22.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 70% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-18.

Phaedon cochleariae - thử nghiệm phun

Dung môi:	78,0	phần khối lượng của axeton
	1,5	phần khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-5, I-6, I-7, I-9, I-10, I-14.

Spodoptera frugiperda - thử nghiệm phun

Dung môi:	78,0	phần khối lượng axeton
-----------	------	------------------------

1,5 phần khối lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

Các đĩa chứa lá ngô (*Zea mays*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn và sau khi làm khô, ngài sâu keo mùa thu (*Spodoptera frugiperda*) được đưa vào.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-2, I-3, I-5, I-6, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26.

Tetranychus urticae – Thử nghiệm phun, kháng OP

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng của dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol etc

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần trọng lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần trọng lượng dung môi xác định và được pha chế bằng nước chứa chất nhũ hóa nồng độ 1000 ppm cho tới khi đạt được nồng độ mong muốn. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, chế phẩm này được pha loãng bằng nước chứa chất nhũ hóa.

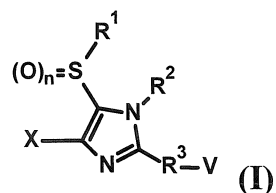
Các đĩa lá đậu (*Phaseolus vulgaris*) được gây nhiễm mật nhện đỏ nhà kính (*Tetranychus urticae*) ở tất cả mọi giai đoạn được phun chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 g/ha: I-10.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I)

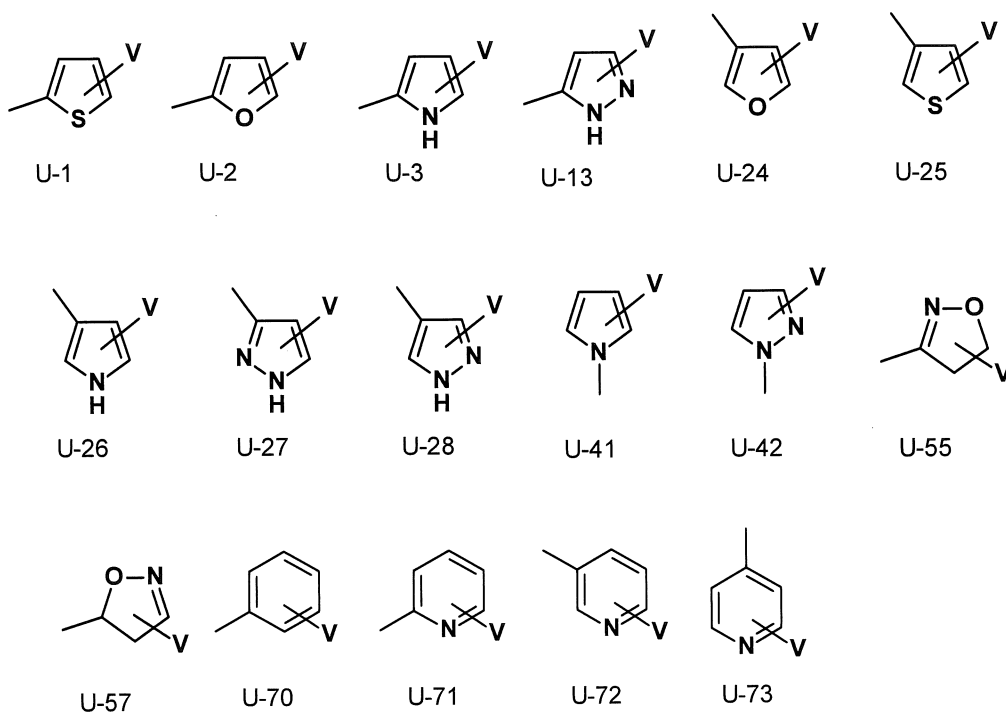


trong đó

R^1 là C_1 - C_6 alkyl,

R^2 là C_1 - C_6 alkyl,

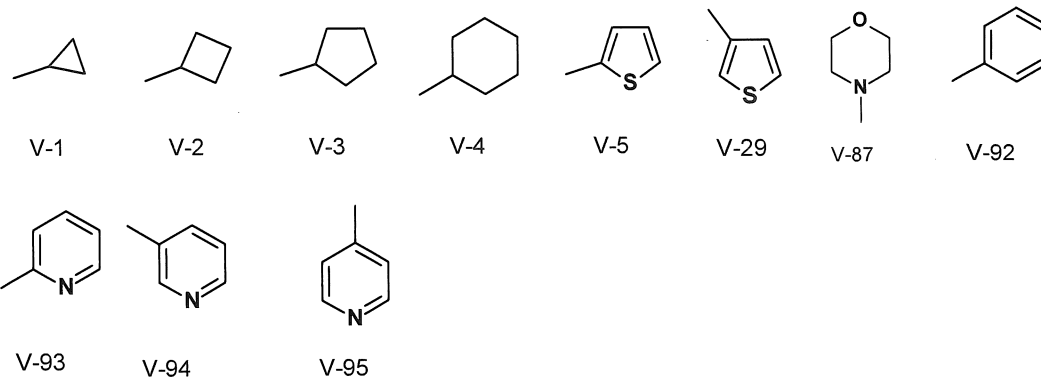
R^3 -V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72 và U-73, trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,



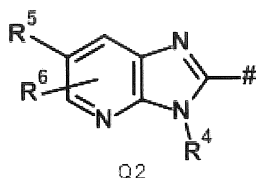
trong đó

V là vòng có 3 đến 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần

tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94 và V-95, trong đó các phần tử thể trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,



X là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh Q2,



R⁴ là C₁-C₆ alkyl,

R⁵, R⁶ độc lập với nhau là hydro hoặc C₁-C₆ haloalkyl,

n là 2.

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

R¹ là C₁-C₄ alkyl,

R² là C₁-C₄ alkyl,

R³-V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thể giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72 và U-73, trong đó các phần tử thể trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,

trong đó

V là vòng có 3 đến 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94 và V-95, trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,

X là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh Q2,

R⁴ là C₁-C₄ alkyl,

R⁵, R⁶ độc lập với nhau là hydro hoặc C₁-C₄ haloalkyl,

n là 2.

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

R¹ là C₁-C₄ alkyl,

R² là C₁-C₄ alkyl,

R³-V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72 và U-73, trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,

trong đó

V là vòng có 3 đến 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau từ các nhóm V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94 và V-95, trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp là: xyano hoặc halogen,

X là hệ vòng dị vòng thơm hai vòng ngưng tụ 9 cạnh Q2,

R⁴ là C₁-C₄ alkyl,

R⁵ là C₁-C₄ haloalkyl,

R⁶ là hydro,

n là 2.

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

R^1 là metyl, etyl, n-propyl, hoặc isopropyl,

R^2 là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, hoặc tert-butyl,

R^3 -V là vòng có 5 hoặc 6 cạnh tùy ý được thế một lần từ nhóm U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72, và U-73, trong đó các phần tử thế trong mỗi trường hợp là: xyano, flo, clo, hoặc brom,

trong đó

V là vòng có 3 đến 6 cạnh tùy ý được thế một lần hoặc hai lần bằng các phần tử thế giống nhau hoặc khác nhau được chọn từ xyano, flo, clo, hoặc brom, được chọn từ V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94, và V-95,

X là hệ vòng dị vòng thơm Q2,

R^4 là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, hoặc tert-butyl,

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

R^6 là hydro,

n là 2.

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

R^1 là etyl,

R^2 là metyl,

R^3 -V là vòng, tùy ý được thế một lần bằng xyano hoặc brom, từ các nhóm U-1, U-13, U-28, U-41, U-42, U-57, U-70, U-71 và U-72,

trong đó

V là vòng, tùy ý được thế một lần bằng xyano, flo hoặc clo, từ các nhóm V-1, V-5, V-87, V-92, V-93 và V-94,

X là hệ vòng dị vòng thơm từ nhóm Q2,

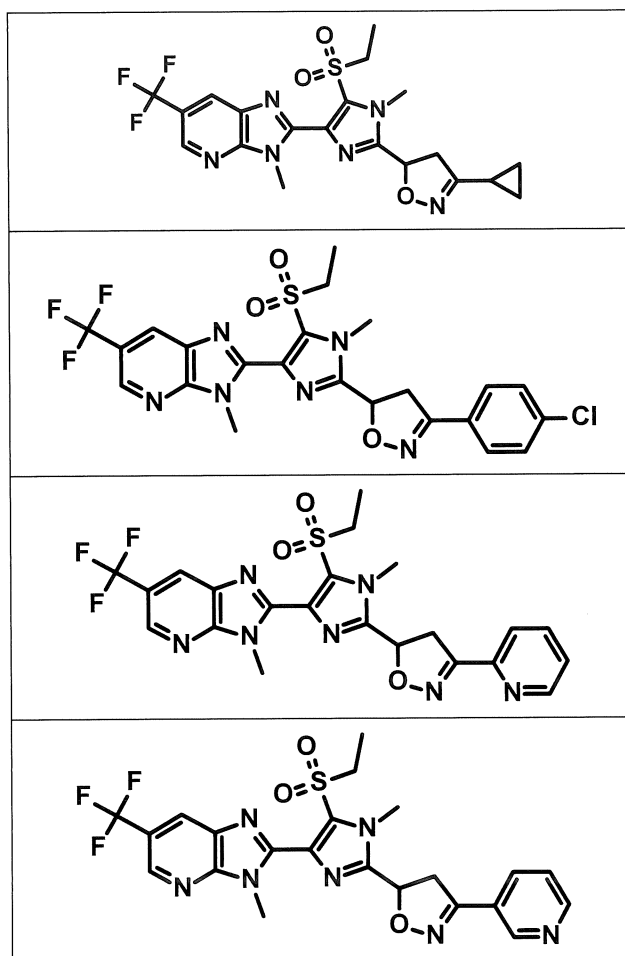
R⁴ là methyl,

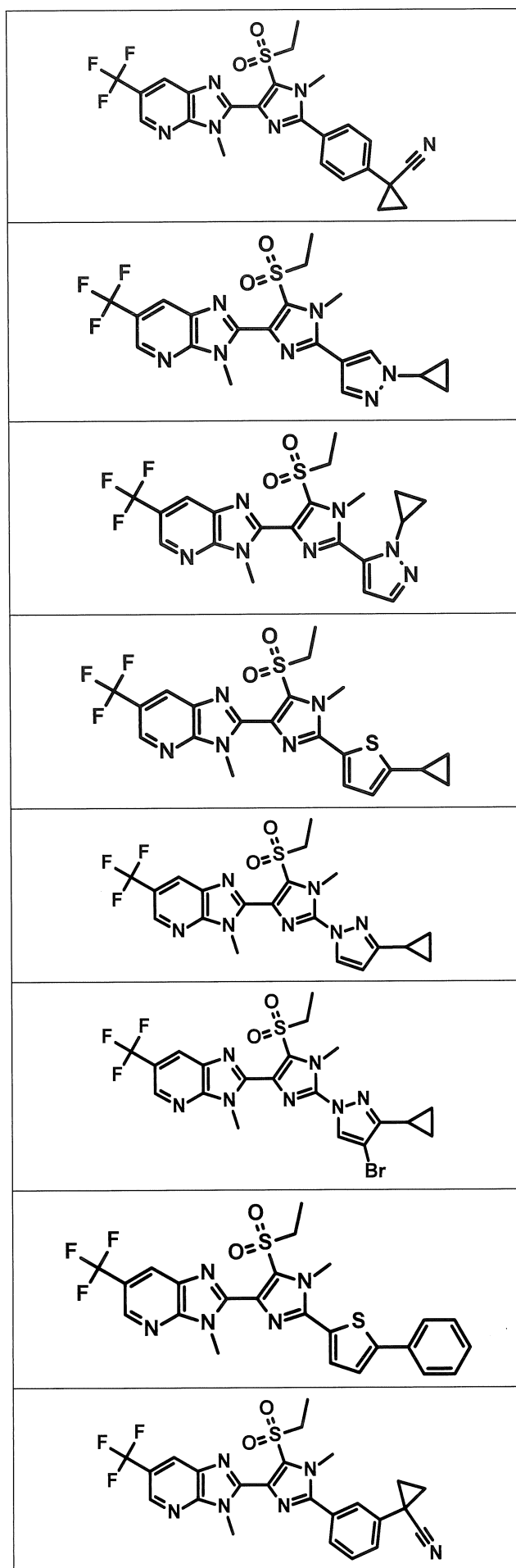
R⁵ là triflometyl hoặc pentafluoretyl,

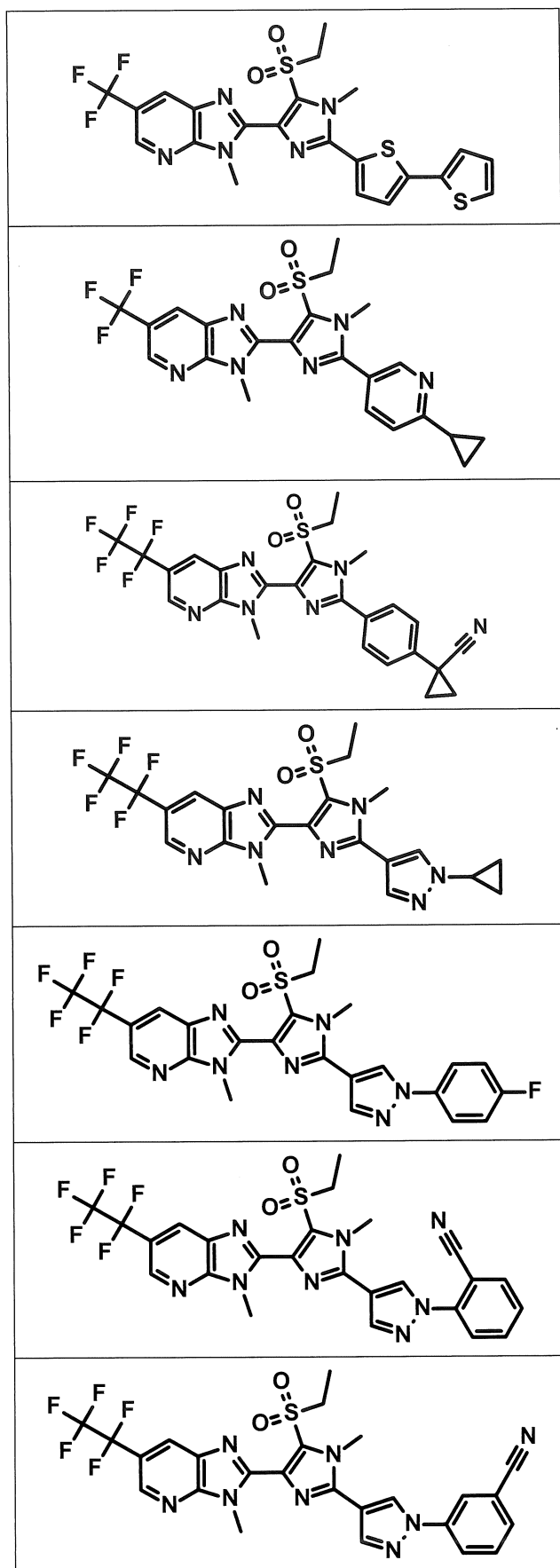
R⁶ là hydro,

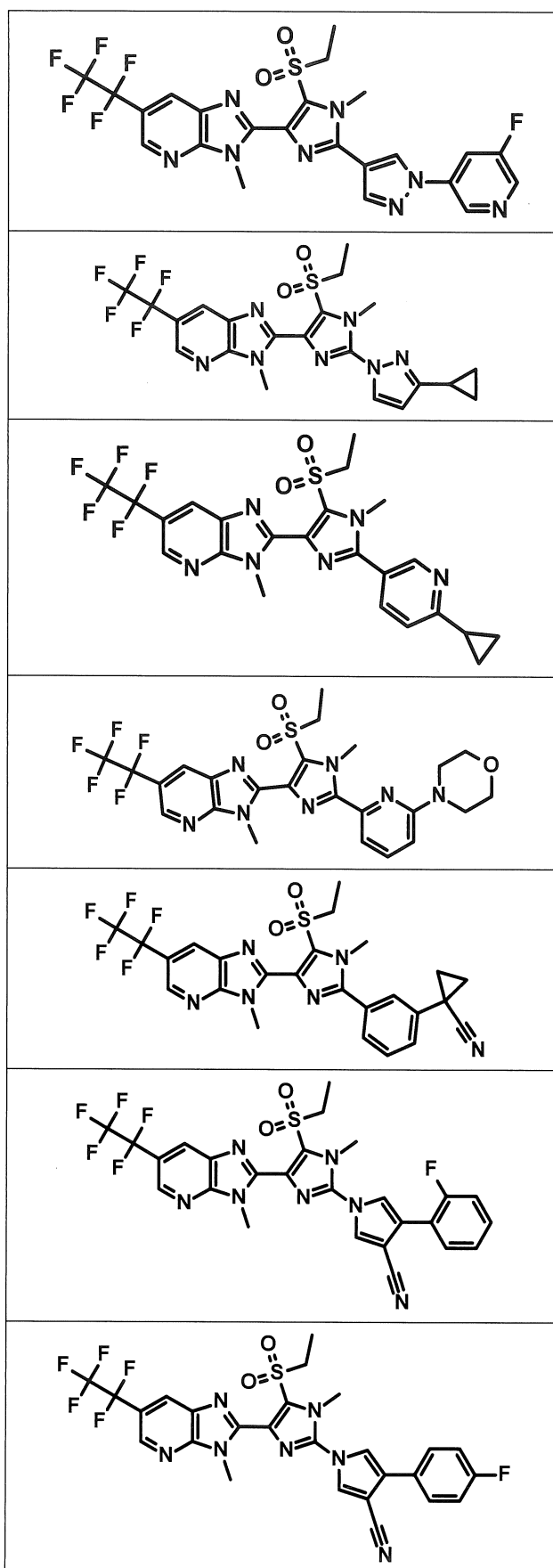
n là 2.

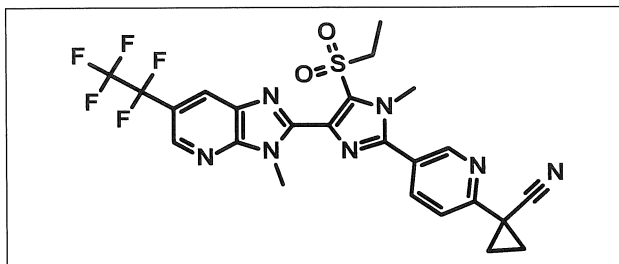
6. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó hợp chất này có cấu trúc như sau:











7. Chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và cả các chất độn và/hoặc các chất hoạt động bề mặt.
8. Chế phẩm hóa nông theo điểm 7, trong đó chế phẩm này còn chứa thêm hợp chất có hoạt tính hóa nông khác.
9. Phương pháp để phòng trừ động vật gây hại, khác biệt ở chỗ hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc chế phẩm hóa nông theo điểm 7 hoặc 8 được cho tác động lên các động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng; trong đó phương pháp này không nhằm mục đích chẩn đoán hoặc điều trị.