



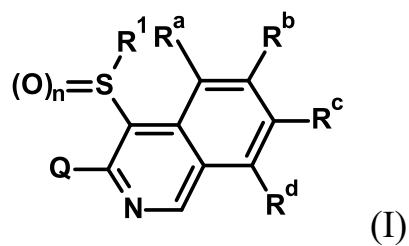
(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11) 
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ
1-0045254
(51)^{2020.01} C07D 471/04; C07D 487/04; A01N (13) B
43/90

(21) 1-2021-05513 (22) 24/02/2020
(86) PCT/EP2020/054746 24/02/2020 (87) WO2020/173860 03/09/2020
(30) PCT/CN2019/076145 26/02/2019 IB
(45) 25/04/2025 445 (43) 25/11/2021 404A
(71) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)
Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Germany
(72) HOFFMEISTER, Laura (DE); FISCHER, Rüdiger (DE); WILLOT, Matthieu (FR);
HAGER, Dominik (DE); ILG, Kerstin (DE); LINKA, Marc (DE); GÖRGENS,
Ulrich (DE); LÖSEL, Peter (GB); XIANG, Jing (CN); ZHU, Yongkuan (CN);
TURBERG, Andreas (DE).
(74) Công ty Luật TNHH T&G (TGVN)

(54) HỢP CHẤT DỊ VÒNG HAI VÒNG NGỪNG TỤ LÀM CHẤT DIỆT SINH VẬT
GÂY HẠI, CHẾ PHẨM HÓA NÔNG CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG
PHÁP ĐỂ PHÒNG TRỪ ĐỘNG VẬT GÂY HẠI

(21) 1-2021-05513

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



trong đó Q, R¹, R^a, R^b, R^c, R^d và n có nghĩa như đã nêu ở trên.

Các hợp chất này là hữu dụng làm chất diệt ve bét và/hoặc chất diệt côn trùng để phòng trừ động vật gây hại. Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm hóa nông chứa các hợp chất này và phương pháp để phòng trừ động vật gây hại bằng cách sử dụng hợp chất hoặc chế phẩm hóa nông này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

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

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ có tính chất diệt côn trùng đã được mô tả trong tài liệu tham khảo, ví dụ, trong WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, WO 2015/121136, WO 2015/198859, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/124563, WO 2016/124557, WO 2016/091731, WO 2016/039444, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286, WO 2016/046071, WO 2017/072039.

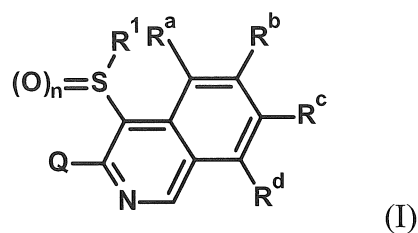
Các chế phẩm bảo vệ cây trồng hiện đại cần phải đáp ứng nhiều yêu cầu, ví dụ, liên quan đến phạm vi, độ tồn dư và phổ tác dụng và mục đích sử dụng có thể của chúng. Các vấn đề về độc tính, bảo tồn các loài có lợi và thực vật thụ phấn, các đặc tính môi trường, tỷ lệ áp dụng, khả năng tương thích với các 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 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 hai vòng ngưng tụ mới đã được phát hiện, chúng có ưu điểm hơn so với các hợp chất đã biết, ví dụ bao gồm các đặc tính sinh học hoặc môi trường tốt hơn, phạm vi các phương pháp áp dụng rộng hơn, hoạt tính diệt côn trùng hoặc diệt ve bét tốt hơn, và khả năng tương thích tốt với thực vật hữu ích. Các dẫn xuất dị vòng hai vòng ngưng tụ này có thể được sử dụng kết hợp với các tác nhân khác để cải thiện hiệu lực, đặc biệt là hiệu lực chống lại 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)

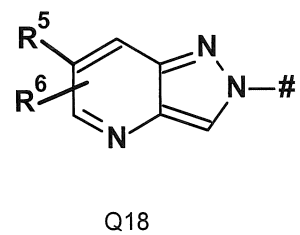
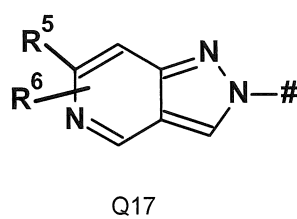
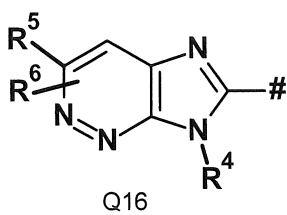
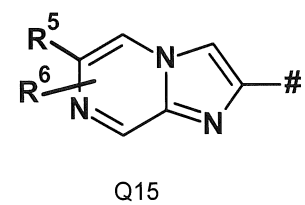
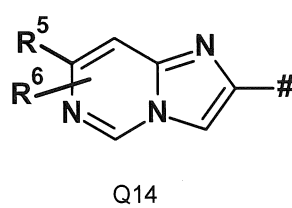
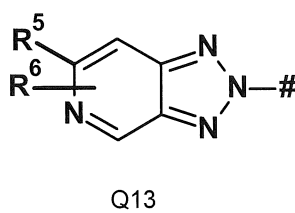
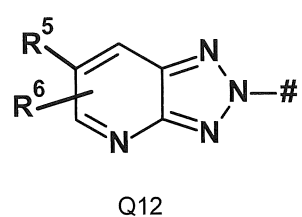
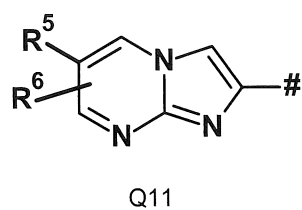
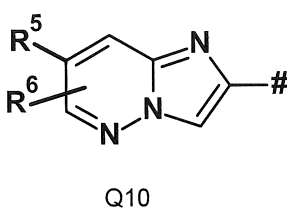
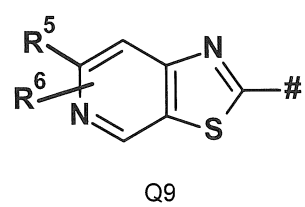
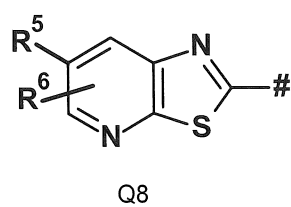
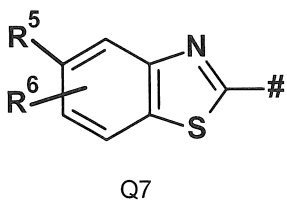
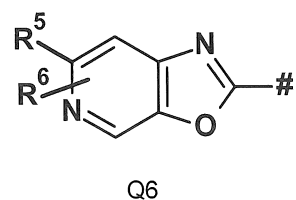
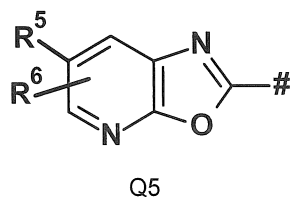
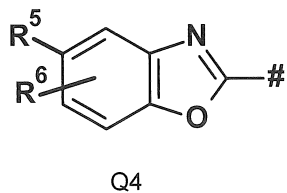
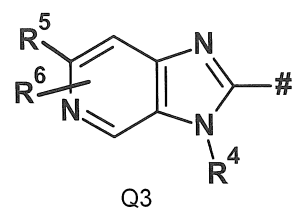
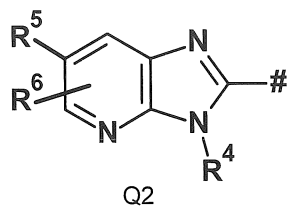
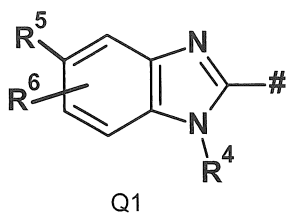
R^1 là (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-xyanoalkyl, (C₁-C₆)-hydroxyalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkoxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-alkenyloxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-haloalkenyloxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-haloalkenyl, (C₂-C₆)-xyanoalkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, (C₂-C₆)-alkynyloxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-haloalkynyloxy-(C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-haloalkynyl, (C₂-C₆)-xyanoalkynyl, (C₃-C₈)-xycloalkyl, (C₃-C₈)-xycloalkyl-(C₃-C₈)-xycloalkyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₈)-xycloalkyl, amino, (C₁-C₆)-alkylamino, di-(C₁-C₆)-alkylamino, (C₃-C₈)-xycloalkylamino, (C₁-C₆)-alkylcarbonylamino, (C₁-C₆)-alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkylthio-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkylsulfinyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkylsulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkylcarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkylcarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkylsulfonylamino, aminosulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl, hoặc di-(C₁-C₆)-alkylaminosulfonyl-(C₁-C₆)-alkyl,

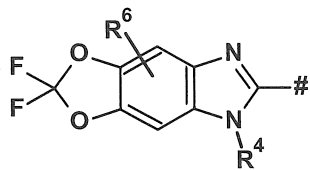
R^a, R^b, R^c, R^d độc lập với nhau là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl,

hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)-alkylsilyl, (C₃-C₈)-xycloalkyl, (C₃-C₈)-xycloalkyl-(C₃-C₈)-xycloalkyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₈)-xycloalkyl, (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, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₁-C₆)-xyanoalkoxy, (C₁-C₆)-alkoxycarbonyl-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-alkylhydroxyimino, (C₁-C₆)-alkoxyimino, (C₁-C₆)-alkyl-(C₁-C₆)-alkoxyimino, (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)-alkylthiocarbonyl, (C₁-C₆)-haloalkylcarbonyl, (C₁-C₆)-alkylcarbonyloxy, (C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, aminocarbonyl, (C₁-C₆)-alkylaminocarbonyl, (C₁-C₆)-alkylaminothiocarbonyl, di-(C₁-C₆)-alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₆)-alkylaminothiocarbonyl, (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, NHCO-(C₁-C₆)-alkyl ((C₁-C₆)-alkylcarbonylamino), NHCO-O(C₁-C₆)-alkyl ((C₁-C₆)-alkoxycarbonylamino) hoặc NHCO-(C₃-C₈)-xycloalkyl ((C₃-C₈)-xycloalkylcarbonylamino),

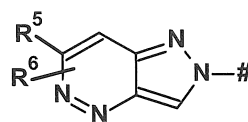
trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thế khác với hydro,

Q là hệ vòng gồm hai vòng hoặc ba vòng dị thơm ngưng tụ có 9 hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm Q1 đến Q20,





Q19



Q20

R^4 là (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) -alkynyloxy- (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -haloalkynyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl- (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_1-C_6) -alkyl- (C_3-C_6) -xycloalkyl, halo- (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_1-C_6) -alkylthio- (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -alkylsulfinyl- (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -alkylsulfonyl- (C_1-C_6) -alkyl hoặc (C_1-C_6) -alkylcarbonyl- (C_1-C_6) -alkyl,

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_6) -xycloalkyl, (C_3-C_6) -xycloalkyl- (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_1-C_6) -alkyl- (C_3-C_6) -xycloalkyl, (C_1-C_6) -alkoxy, (C_1-C_6) -haloalkoxy, (C_1-C_6) -alkoxyimino, (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) -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,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là (C_1-C_6) -haloalkyl.

Ngoài ra, cũng đã phát hiện ra rằng các hợp chất có công thức (I) có hiệu lực rất tốt làm chất diệt sinh vật gây hại, tốt hơn là làm chất diệt côn trùng và/hoặc chất diệt ve bét, và nói chung còn có khả năng tương hợp rất tốt với thực vật, đặc biệt là với cây trồng.

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

Cấu hình 2-1

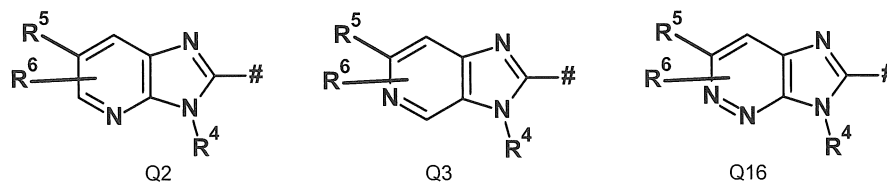
R^1 tốt hơn là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-hydroxyalkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-xyanoalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-alkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-xyanoalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-alkynyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkynyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₂-C₄)-xyanoalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino, (C₃-C₆)-xycloalkylamino, (C₁-C₄)-alkylcarbonylamino, (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, (C₁-C₄)-alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl, hoặc (C₁-C₄)-alkylsulfonylamino,

R^a, R^b, R^c, R^d độc lập với nhau tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, axetyl, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₄)-alkylsilyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (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, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-xyanoalkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-alkyl-(C₁-C₄)-alkoxyimino, (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, aminothiocarbonyl, (C₁-C₄)-alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)-alkyl-aminocarbonyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)-alkylamino, di-(C₁-C₄)-alkylamino, aminosulfonyl, (C₁-C₄)-alkylaminosulfonyl, di-(C₁-C₄)-alkylaminosulfonyl, aminothiocarbonyl, NHCO-(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkylcarbonylamino), NHCO-O(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkoxycarbonylamino) hoặc NHCO-(C₃-C₆)-xycloalkyl ((C₃-C₆)-xycloalkylcarbonylamino),

trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thế khác với

hydro,

Q tốt hơn là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3, Q16,



R⁴ tốt hơn là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-xyanoalkyl, (C₁-C₄)-hydroxyalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-alkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-xyanoalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-alkynyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl-(C₁-C₄)-alkyl hoặc (C₁-C₄)-alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl,

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)alkoxy, (C₁-C₄)haloalkoxy, (C₁-C₄)alkoxyimino, (C₁-C₄)alkylthio, (C₁-C₄)haloalkylthio, (C₁-C₄)alkylsulfinyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)haloalkylsulfonyl, (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 hoặc di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl,

n tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là (C₁-C₄)-haloalkyl.

Cấu hình 3-1

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

(C₁-C₄)-alkylsulfonyl-(C₁-C₄)-alkyl,

R^a, R^b, R^c, R^d độc lập với nhau đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, halogen, nitro, hydroxy, amino, SCN, tri-(C₁-C₄)-alkylsilyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-xyanoalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-xyanoalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₂-C₄)-xyanoalkynyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-xyanoalkoxy, (C₁-C₄)-alkylhydroxyimino, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-alkyl-(C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, (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, NHCO-(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkylcarbonylamino), NHCO-O-(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkoxycarbonylamino) hoặc NHCO-(C₃-C₆)-xycloalkyl ((C₃-C₆)-xycloalkylcarbonylamino),

trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thế khác với hydro,

Q đặc biệt tốt hơn là hệ vòng gồm hai vòng hoặc ba vòng dị thơm ngưng tụ có 9 hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 và Q16,

R⁴ đặc biệt tốt hơn là (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-xyanoalkyl, (C₁-C₄)-hydroxyalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-alkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-xyanoalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-alkynyloxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, halo-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkylthio-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl-(C₁-C₄)-alkyl hoặc (C₁-C₄)-alkylcarbonyl-(C₁-C₄)-alkyl,

R⁵, R⁶ tốt hơn nữa độc lập là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₂-C₄)-alkenyl, (C₂-C₄)-haloalkenyl, (C₂-C₄)-alkynyl, (C₂-C₄)-haloalkynyl,

(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, (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 hoặc di-(C₁-C₄)-alkylaminosulfonyl,

n đặc biệt tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Q là Q₂, R^c không là (C₁-C₄)-haloalkyl.

Cấu hình 4-1

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

R^a, R^b, R^c, R^d rất đặc biệt tốt hơn là độc lập với nhau là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, NHCO-(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkylcarbonylamino), NHCO-O(C₁-C₄)-alkyl ((C₁-C₄)-alkoxycarbonylamino) hoặc NHCO-(C₃-C₆)-xycloalkyl ((C₃-C₆)-xycloalkylcarbonylamino),

trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phân tử thể khác với hydro,

Q rất đặc biệt tốt hơn là hệ vòng gồm hai vòng hoặc ba vòng dị thơm ngưng tụ có 9 hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm Q₂, Q₃ và Q₁₆,

R⁴ rất đặc biệt tốt hơn là (C₁-C₄)-alkyl hoặc (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl,

R⁵ rất đặc biệt tốt hơn là hydro, xyano, halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₃-C₆)-xycloalkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₆)-xycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkoxyimino, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₁-C₄)-haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)-alkylcarbonyl, (C₁-C₄)-haloalkylcarbonyl,

(C₄)haloalkylcarbonyl, (C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, di-(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, (C₁-C₄)alkylsulfonylamino, (C₁-C₄)alkylaminosulfonyl hoặc di-(C₁-C₄)alkylaminosulfonyl,

R⁶ rất đặc biệt tốt hơn là hydro,

n rất đặc biệt tốt hơn là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là (C₁-C₆)-haloalkyl.

Cấu hình 5-1

R¹ đặc biệt là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^a, R^b, R^c, R^d độc lập với nhau cụ thể là hydro, flo, clo, brom, iot, xyano, metyl, etyl, xyclopropyl, xyclobutyl, metoxy, etylsulfonyl, diflometyl, triflometyl, triflometoxy, triflometylthio, trifloetylthio, trifloetylsulfinyl, trifloetylsulfonyl, difloetoxy, trifloetoxy, metyl(carbonyl)amino, etyl(carbonyl)amino, xyclopropyl(carbonyl)amino hoặc metoxy(carbonyl)amino,

trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

Q cụ thể là hệ vòng gồm hai vòng dị thom ngưng tụ có 9 hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 và Q16,

R⁴ cụ thể là metyl, etyl, isopropyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R⁵ cụ thể là flo, clo, brom, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl (CH₂CFH₂, CHFCH₃), difloetyl (CF₂CH₃, CH₂CHF₂, CHFCHF₂), trifloetyl, (CH₂CF₃, CHFCHF₂, CF₂CHF₂), tetrafloetyl (CHFCHF₃, CF₂CHF₂), pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfinyl hoặc triflometylsulfonyl,

R⁶ cụ thể là hydro,

n cụ thể là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là diflometyl hoặc triflometyl.

Cấu hình 5-2

R^1 đặc biệt là methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, xyclopropyl, n-butyl, isobutyl, tert-butyl, xyclobutyl, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl, difloetyl, trifloetyl, tetrafloetyl hoặc pentafloetyl,

R^a, R^b, R^c, R^d độc lập với nhau cụ thể là hydro, flo, clo, brom, iot, xyano, methyl, ethyl, xyclopropyl, xyclobutyl, metoxy, etylsulfonyl, diflometyl, triflometyl, triflometoxy, triflometylthio, trifloetylthio, trifloetylsulfinyl, trifloetylsulfonyl, difloetoxo, trifloetoxo, diflopropoxo, methyl(carbonyl)amino, ethyl(carbonyl)amino, xyclopropyl(carbonyl)amino hoặc metoxy(carbonyl)amino,

trong đó ít nhất một trong các gốc R^a, R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thế khác với hydro,

Q cụ thể là hệ vòng gồm hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 hoặc 12 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 và Q16,

R^4 cụ thể là methyl, ethyl, isopropyl, metoxymetyl hoặc metoxyetyl,

R^5 cụ thể là flo, clo, brom, flometyl, diflometyl, triflometyl, floetyl (CH_2CFH_2 , CHFCH_3), difloetyl (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , CHFCHF_2), trifloetyl, (CH_2CF_3 , CHFCHF_2 , CF_2CFH_2), tetrafloetyl (CHFCH_3 , CF_2CHF_2), pentafloetyl, triflometoxy, difloclometoxy, dicloflometoxy, triflometylthio, triflometylsulfinyl hoặc triflometylsulfonyl,

R^6 cụ thể là hydro,

n cụ thể là 0, 1 hoặc 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là diflometyl hoặc triflometyl.

Cấu hình 6-1

R^1 đặc biệt là ethyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro, methyl, diflometyl, triflometyl hoặc clo,

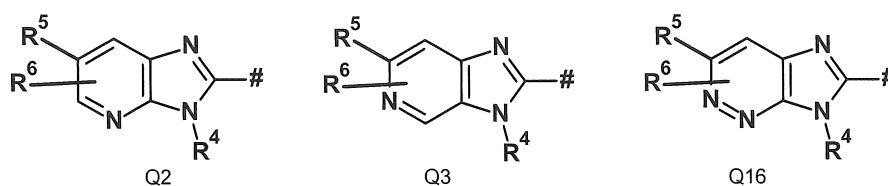
R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, methyl, xyclopropyl, diflometyl, triflometyl, metoxy, methyl(carbonyl)amino ($-\text{NH}-\text{CO}-\text{Me}$), xyclopropyl(carbonyl)amino ($-\text{NH}-\text{CO}-\text{xyclopropyl}$), metoxy(carbonyl)amino ($-\text{NH}-$

CO-OMe), etylsulfonyl, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy hoặc 2,2,2-trifloetylthio (2,2,2-trifloethylsulfanyl: -SCH₂CF₃),

R^d đặc biệt là hydro, brom, clo, xyano, hoặc triflometyl,

trong đó một trong các gốc R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 và Q16,



R⁴ đặc biệt là metyl,

R⁵ đặc biệt là triflometyl, pentaflöetyl, triflometoxy hoặc triflometylsulfonyl,

R⁶ đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là diflometyl hoặc triflometyl.

Cấu hình 6-1a

R¹ đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro hoặc triflometyl,

R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, metyl, xyclopropyl, metoxy, metyl(carbonyl)amino (-NH-CO-Me), xyclopropyl(carbonyl)amino (-NH-CO-xyclopropyl), metoxy(carbonyl)amino (-NH-CO-OMe), etylsulfonyl, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy hoặc 2,2,2-trifloetylthio,

R^d đặc biệt là hydro, brom, clo, xyano, hoặc triflometyl,

trong đó một trong các gốc R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm gồm Q2,

R⁴ đặc biệt là metyl,

R⁵ đặc biệt là triflometyl, pentaflöetyl, triflometoxy hoặc triflometylsulfonyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Cấu hình 6-1b

R^1 đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro,

R^c đặc biệt là hydro,

R^d đặc biệt là brom, xyano, hoặc triflometyl,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm

Q3,

R^4 đặc biệt là metyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl hoặc pentafluoretyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Cấu hình 6-1c

R^1 đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro, metyl, diflometyl, triflometyl hoặc clo,

R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

R^d đặc biệt là hydro, brom hoặc clo,

trong đó một trong các gốc R^b , R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm

Q16,

R^4 đặc biệt là metyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl hoặc pentafluoretyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Cấu hình 6-2

R¹ đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

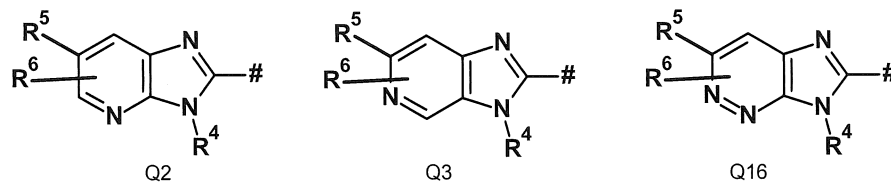
R^b đặc biệt là hydro, metyl, diflometyl, triflometyl hoặc clo,

R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, metyl, xyclopropyl, diflometyl, triflometyl, metoxy, methyl(carbonyl)amino (-NH-CO-Me), xyclopropyl(carbonyl)amino (-NH-CO-xyclopropyl), metoxy(carbonyl)amino (-NH-CO-OMe), etylsulfonyl, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2,2-diflopropoxy (-OCH₂CF₂CH₃) hoặc 2,2,2-trifloetylthio (2,2,2-trifloethylsulfanyl: -SCH₂CF₃),

R^d đặc biệt là hydro, brom, clo, xyano, hoặc triflometyl,

trong đó một trong các gốc R^b, R^c hoặc R^d là phân tử thể khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 và Q16,



R⁴ đặc biệt là metyl,

R⁵ đặc biệt là triflometyl, pentafloretyl, triflometoxy hoặc triflometylsulfonyl,

R⁶ đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2,

trong đó, nếu Q là Q2, R^c không là diflometyl hoặc triflometyl.

Cấu hình 6-2a

R¹ đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro hoặc triflometyl,

R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, metyl, xyclopropyl, metoxy, metyl(carbonyl)amino (-NH-CO-Me), xyclopropyl(carbonyl)amino (-NH-CO-xyclopropyl), metoxy(carbonyl)amino (-NH-CO-OMe), etylsulfonyl, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2,2-diflopropoxy (-OCH₂CF₂CH₃) hoặc 2,2,2-trifloetylthio,

R^d đặc biệt là hydro, brom, clo, xyano, hoặc triflometyl,

trong đó một trong các gốc R^b , R^c hoặc R^d là phân tử thế khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q2,

R^4 đặc biệt là metyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl, pentafloretyl, triflometoxy hoặc triflometylsulfonyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Cấu hình 6-2b

R^1 đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro,

R^c đặc biệt là hydro,

R^d đặc biệt là brom, xyano, hoặc triflometyl,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q3,

R^4 đặc biệt là metyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl hoặc pentafloretyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Cấu hình 6-2c

R^1 đặc biệt là etyl,

R^a đặc biệt là hydro,

R^b đặc biệt là hydro, methyl, diflometyl, triflometyl hoặc clo,

R^c đặc biệt là hydro, clo, brom, xyano, methyl, diflometyl hoặc triflometyl,

R^d đặc biệt là hydro, brom hoặc clo,

trong đó một trong các gốc R^b , R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

Q đặc biệt là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q16,

R^4 đặc biệt là methyl,

R^5 đặc biệt là triflometyl hoặc pentafloretyl,

R^6 đặc biệt là hydro,

n đặc biệt là 2.

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q2 và R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^a , R^b , R^c , R^d và n như được xác định 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) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q3 và R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^a , R^b , R^c , R^d và n như được xác định 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) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q16 và R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^a , R^b , R^c , R^d và n như được xác định 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) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q3 hoặc Q16 và R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^a , R^b , R^c , R^d và n như được xác định 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) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2).

Theo một phương án ưu tiên, sáng chế đề cập đến các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 và Q, R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^a , R^b , R^c và R^d như được xác định 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) hoặc cấu hình (6-1) hoặc cấu hình (6-2).

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 C₁-C₁₂-alkyl là metyl, etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-metylbutyl, 2-metylbutyl, 1-etylpropyl, 1,2-dimetylpropyl, hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-dexyl, n-undexyl và n-dodexyl. Trong số các gốc alkyl này, đặc biệt ưu tiên đối với các gốc C₁-C₆-alkyl. Đặc biệt được ưu tiên là các gốc C₁-C₄-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 C₂-C₁₂-alkenyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết đôi, ví dụ, vinyl, alyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butadienyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3-pentadienyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl và 1,4-hexadienyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₂-C₆-alkenyl và đặc biệt ưu tiên là các gốc C₂-C₄-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 C₂-C₁₂-alkynyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có ít nhất một liên kết ba, ví dụ, etynyl, 1-propynyl và propargyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₃-C₆-alkynyl và đặc biệt ưu tiên là các gốc C₃-C₄-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 C₃-C₈-xycloalkyl, ví dụ xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclohexyl, xycloheptyl và xyclooctyl. Trong số này, được ưu tiên là các gốc C₃-C₆-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 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 các gốc này có thể được kết hợp với nhau nếu muốn, tức là bao gồm các tổ hợp nằm trong các phạm vi ưu tiên tương ứng.

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

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

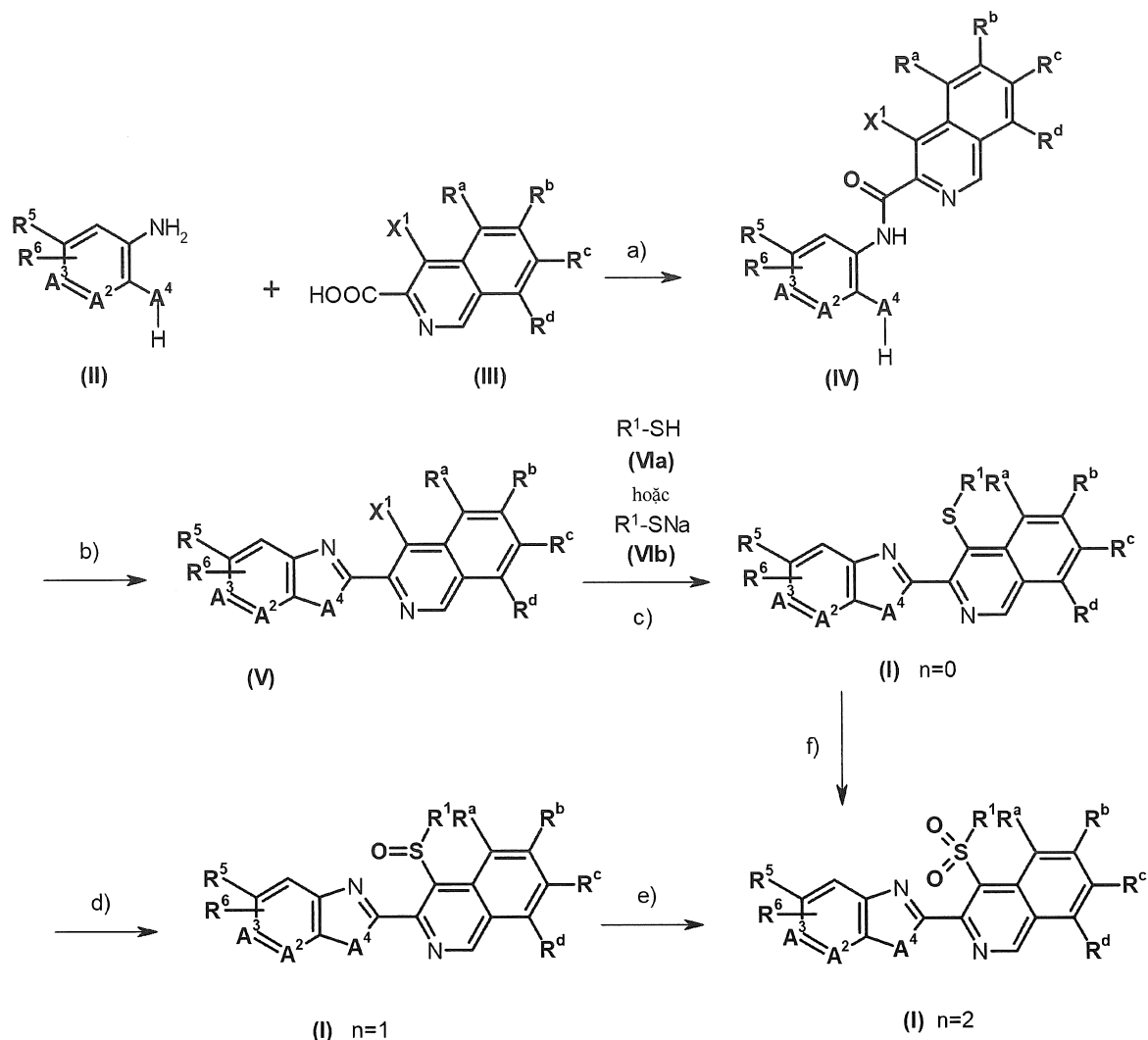
Đặc biệt nhấn mạnh theo sáng chế là việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) mà chứa sự kết hợp của các nghĩa được liệt kê trên đây làm phương án được nhấn mạnh một cách đặc biệt.

Tùy thuộc vào bản chất của các nhóm 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 đồng phân tương ứng với 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 bởi các quy trình được thể hiện trong các sơ đồ dưới đây:

Quy trình A

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q1 đến Q9, Q16 hoặc Q19 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 và WO2015/121136.



Các gốc R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R^a, R^b, R^c, R^d và n có nghĩa nêu trên, A² và A³ là CH hoặc N, A⁴ là O, S hoặc N-R⁴, và X¹ là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (IV) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong US5576335 bằng phản ứng giữa các hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (III) với sự có mặt của chất làm ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/69257, WO2006/65703, WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 hoặc WO2015/000715.

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế

được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong các quy trình H và I.

Phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (III) có thể được thực hiện ở dạng nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên tiến hành phản ứng trong dung môi được chọn từ dung môi thông thường là trơ trong điều kiện phản ứng thông thường. Được ưu tiên là các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; các hydrocarbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Các tác nhân ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, các carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các bicarbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, đặc biệt ưu tiên natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri bicarbonat, kali bicarbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (V) có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (IV), ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 và WO2015/121136.

Quy trình chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (V) có thể được thực hiện ở dạng nguyên chất hoặc trong dung môi, tốt hơn là tiến hành phản ứng trong dung môi được chọn từ dung môi thông thường trơ trong điều kiện phản ứng thông thường. Ưu

tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ, axit, bazơ hoặc chất clo hóa.

Ví dụ về tác nhân ngưng tụ thích hợp là các carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI) hoặc 1,3-dixyclohexylcarbodiimit; các 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.

Ví dụ về các axit thích hợp mà có thể được sử dụng trong phản ứng đã được mô tả là các axit sulfonic như axit para-toluenulfonic; axit carboxylic như axit axetic, hoặc axit polyphosphoric.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là dị vòng nitơ như pyridin, picolin, 2,6-lutidin, 1,8-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.

Ví dụ về tác nhân clo hóa thích hợp là phospho oxyclorea.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước c)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức (V) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ hoặc bằng phản ứng với hợp chất có công thức (VIb).

Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ methyl mercaptan, etyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications,

13 (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Quy trình chuyển hóa thành hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 0 có thể được thực hiện ở dạng nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên tiến hành phản ứng trong dung môi được chọn từ dung môi thông thường mà trợ trong điều kiện phản ứng thông thường. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl methyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulfoxit.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm bao gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Ở đây, ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan (hợp chất có công thức (VIb)), ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung bazơ khác. Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Trong phản ứng được mô tả, X^1 tốt hơn là flo hoặc nguyên tử clo.

Tương tự, nếu R^a , R^b , R^c hoặc R^d là halogen (ví dụ clo hoặc flo), ví dụ bằng việc sử dụng methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, cũng có thể thực hiện việc trao đổi nhiều lần với alkyl mercaptan cũng như thế một lần X^1 .

Bước d)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 0. Phản ứng oxy hóa thường được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

Ví dụ về các tác nhân oxy hóa thích hợp là hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic

hoặc natri periodat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 1. Phản ứng oxy hóa này 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 chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

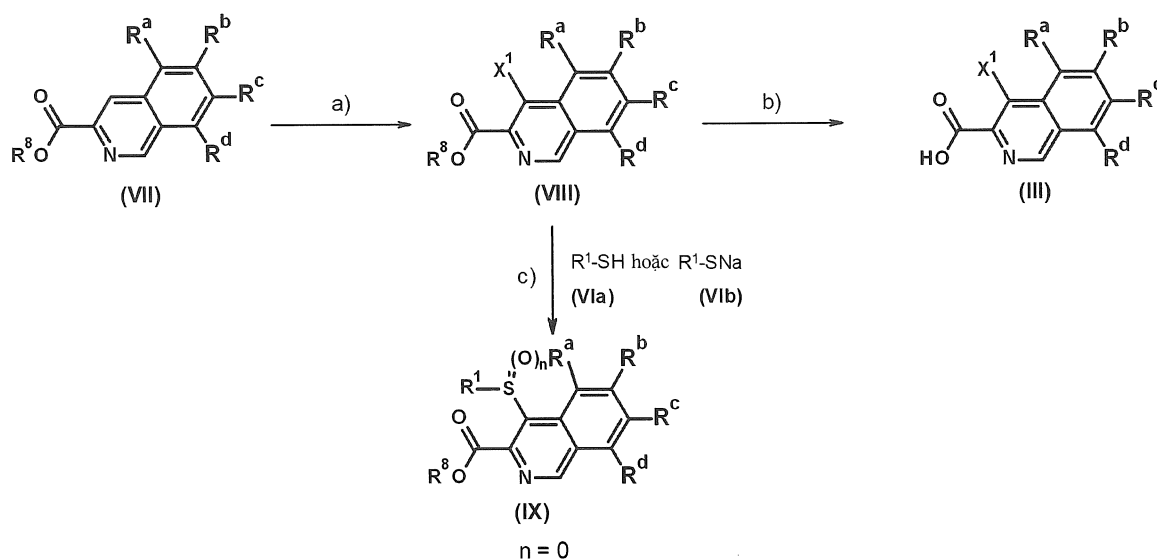
Bước f)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 cũng có thể được điều chế theo quy trình một bước bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa này 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 chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Tương tự, nếu R^a , R^b , R^c hoặc R^d là alkylsulfanyl(=alkylthio), có thể sử dụng tác nhân oxy hóa thích hợp, ví dụ hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic, cũng như bằng cách oxy hóa nguyên tử lưu huỳnh sát cạnh R^1 thành sulfon, để oxy hóa thêm phần tử thể alkylsulfanyl thành alkylsulfonyl.

Quy trình B

Các gốc R^1 , R^a , R^b , R^c , R^d và n có nghĩa được nêu ở trên, X^1 là halogen và R^8 là $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (VIII) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (VII) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion bằng chất halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng cách halogen hóa vòng thơm ái điện tử theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 24 (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146. Các hợp chất có công thức (VII) có bán trên thị trường hoặc có thể được tổng hợp bằng cách este hóa từ các hợp chất có công thức (XXV).

Bước b)

Các hợp chất có công thức (III) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong *Synthesis* 1987, 6, 586-587, *Tetrahedron Letters* 2006, 47, 565-567 hoặc *ChemMedChem* 2010, 5, 65-78 bằng cách thủy phân từ các hợp chất có công thức (VIII).

Ví dụ về các bazơ thích hợp là, ví dụ, lithi hydroxit hoặc natri hydroxit. Các dung môi có thể được sử dụng là dung môi không proton và dung môi proton và hỗn hợp của chúng, ví dụ ethanol, tetrahydrofuran hoặc nước.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Bước c)

Các hợp chất có công thức (IX) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức (VIII) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ hoặc bằng phản ứng với hợp chất có công thức (VIb).

Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Quy trình chuyển hóa thành hợp chất có công thức (IX) trong đó n bằng 0 có thể được thực hiện ở dạng nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên tiến hành phản ứng trong dung môi được chọn từ dung môi thông thường mà trợ trong điều kiện phản ứng thông thường. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyetan, tert-butyl methyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimethylformamid, N-methylpyrrolidon hoặc dimethyl sulfoxit.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm bao gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc kim loại kiềm thổ. Ở đây, ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan (hợp chất có công thức (VIb)), ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung bazơ khác. Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C .

Trong phản ứng được mô tả, X^1 tốt hơn là flo hoặc nguyên tử clo.

Tương tự, nếu R^a , R^b , R^c hoặc R^d là halogen (ví dụ clo hoặc flo), ví dụ bằng việc

sử dụng methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, cũng có thể thực hiện việc trao đổi nhiều lần với alkyl mercaptan cũng như thế một lần X¹.

Quy trình C

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q1 đến Q9, Q16 hoặc Q19 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 và WO2015/121136.

Các gốc R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R^a, R^b, R^c, R^d và n có nghĩa nêu trên, A² và A³ là CH hoặc N, X¹ là halogen, A⁴ là O, S hoặc -NR⁴, và R⁸ là (C₁-C₄)-alkyl.

Các bước a), b)

Các hợp chất có công thức (IXa) trong đó n bằng 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (IX) trong đó n bằng 0. Phản ứng oxy hóa này 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 chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Các hợp chất có công thức (IXb) trong đó n bằng 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (IX) trong đó n bằng 0.

Các hợp chất có công thức (IXa) trong đó n bằng 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (IXb) trong đó n bằng 1.

Bước c)

Các hợp chất có công thức (X) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể điều chế được bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (IX, n=0) (IXa, n=2) hoặc (IXb, n=1) với sự có mặt của bazơ. Phản ứng thủy phân này thường được thực hiện trong dung môi. Ưu tiên sử dụng các rượu như metanol hoặc etanol; nước; ete ví dụ diisopropyl ete,

dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit, N-metylpyrrolidon hoặc dimetyl sulfoxit; hoặc hỗn hợp của các dung môi đã nêu.

Ví dụ về các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ từ nhóm gồm các axetat, các phosphat và các cacbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, ưu tiên sử dụng xesi cacbonat, natri cacbonat và kali cacbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 200°C.

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

Bước d)

Các hợp chất có công thức (XI) có thể điều chế được bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (X) với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/069257, US2012/0319050, WO2011/107998 hoặc WO2010/91310.

Phản ứng giữa hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (X) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trở trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các tác nhân ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI), 1,3-

dixyclohexylcarbodiimit, thionyl clorua hoặc oxalyl clorua.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các bicarbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, đặc biệt ưu tiên natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri bicarbonat, kali bicarbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (XI) với sự có mặt của bazơ.

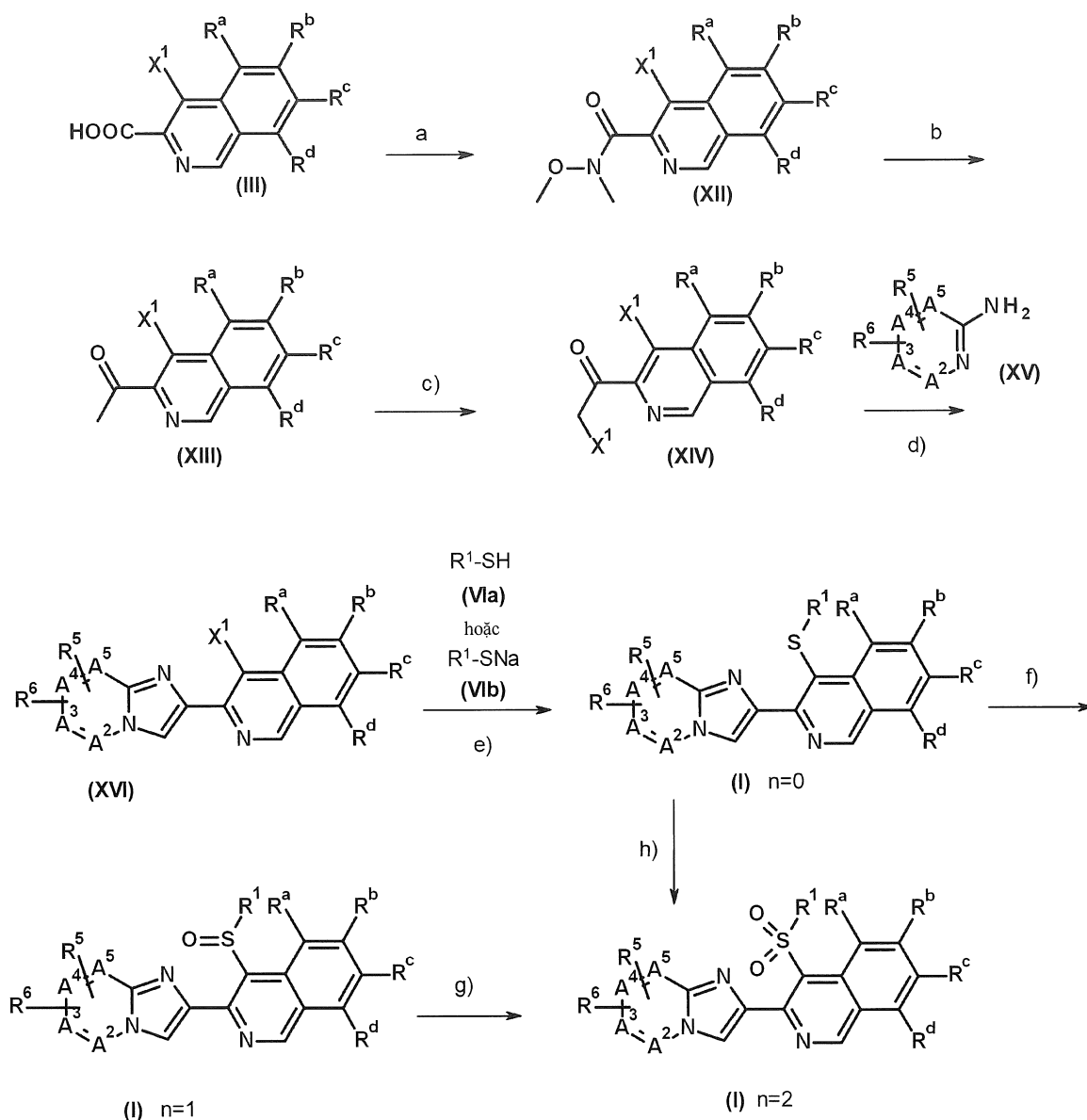
Phản ứng chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0, 1 hoặc 2 có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclohua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các bicarbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, đặc biệt ưu tiên natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri bicarbonat, kali bicarbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Quy trình D

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q10, Q11, Q14 hoặc Q15 có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298, WO2016/071214 hoặc J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595.



Các gốc R¹, R⁵, R⁶, R^a, R^b, R^c, R^d và *n* có nghĩa nêu trên. A², A³ và A⁵ là CH hoặc N, A⁴ là CR⁵ hoặc N (trong đó A², A³, A⁴ và A⁵ đều không là N) và X¹ là halogen.

Bước a)

Các axit carboxylic có công thức (III) được chuyển đổi theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643 hoặc EP2671582 với sự có mặt của

O,N-dimethylhydroxylamin hydroclorua thành amit Weinreb có công thức (XII).

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong các quy trình H và I.

Bước b, c)

Sau đó, các hợp chất có công thức (XII) có thể được chuyển đổi bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/75643, bằng chất phản ứng Grignard, ví dụ metylmagie bromua, thành keton có công thức (XIII). Các hợp chất có công thức (XIV) thu được bằng cách halogen hóa sau đó theo cách tương tự phương pháp đã biết được mô tả, ví dụ, trong tài liệu US2012/302573.

Bước d)

Hợp chất có công thức (XVI) có thể được điều chế bằng cách khép vòng hợp chất có công thức (XIV) bằng amin có công thức (XV). Việc đóng vòng được thực hiện, ví dụ, trong etanol, axetonitril hoặc N,N-dimetylformamit bằng các phương pháp đã biết theo cách tương tự với các quy trình được mô tả, ví dụ, trong WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 hoặc J. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595.

Hợp chất có công thức (XV) có bán trên thị trường.

Bước e)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế bằng cách cho các hợp chất có công thức (XVI) phản ứng với các hợp chất có công thức (VIa) với sự có mặt của bazơ. Các dẫn xuất mercaptan có công thức (VIa), ví dụ methyl mercaptan, ethyl mercaptan hoặc isopropyl mercaptan, có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo các quy trình tương tự như các quy trình được mô tả trong US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 hoặc Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Theo cách khác, có thể dùng trực tiếp các muối của dẫn xuất mercaptan(VIb), ví dụ natri etanthiolat, natri metanthiolat hoặc natri isopropanthiolat, mà không cần bổ sung

bazơ khác.

Bước f, g)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 1 có thể được điều chế bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 0. Quá trình oxy hóa được thực hiện bằng các phương pháp đã biết bằng cách sử dụng tác nhân oxy hóa thích hợp, ví dụ, hydro peroxit, axit meta-cloperbenzoic hoặc natri periodat.

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 1.

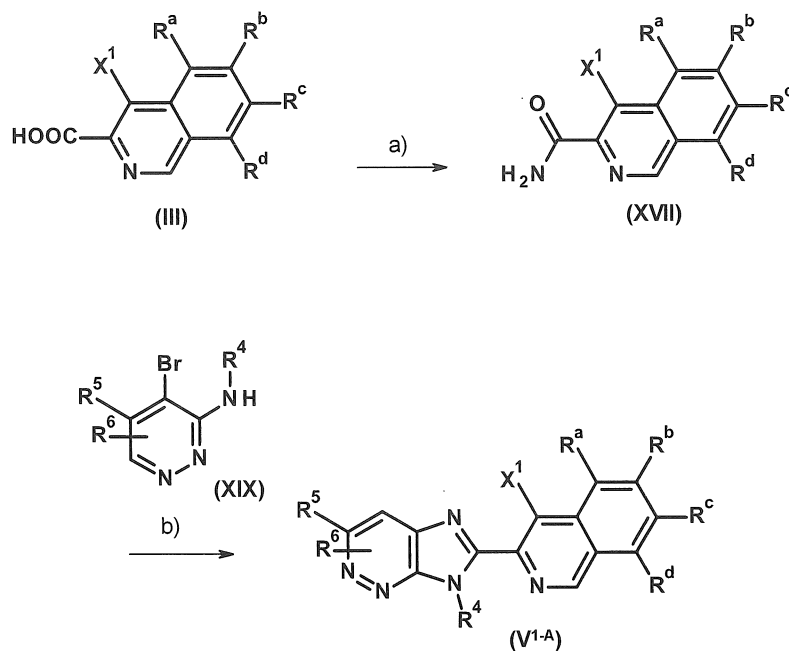
Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Ưu tiên đối với hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ, diclometan, clorofom, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước. Ví dụ về chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic.

Bước h)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 2 cũng có thể được điều chế trong quy trình một bước bằng cách oxy hoá các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 0. Phản ứng oxy hóa này 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 chất oxy hóa thích hợp là hydro peroxit và axit meta-cloperbenzoic.

Quy trình E

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q16 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2014/142292.



Các gốc R^a, R^b, R^c, R^d, R⁴, R⁵ và R⁶ có nghĩa được nêu ở trên. X¹ là halogen.

Bước a)

Hợp chất có công thức (XVII) có thể được điều chế tương tự theo quy trình được mô tả trong tài liệu US5374646 hoặc Bioorganic và Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093 - 1096 bằng cách cho hợp chất có công thức (III) phản ứng với nguồn amoniac với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ.

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết. Các phương pháp điều chế khả dụng được mô tả trong các quy trình H và I.

Phản ứng của hợp chất có công thức (III) với nguồn amoniac tốt hơn được thực hiện trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường tro trong các điều kiện phản ứng thông dụng. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ dioxan hoặc tetrahydrofuran.

Tác nhân ngưng tụ thích hợp là, ví dụ carbonyldiimidazol.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, nếu phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 70°C.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (V^{1-A}) có thể được điều chế theo cách tương tự quy

trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292 bằng cách cho các hợp chất có công thức (XVII) phản ứng với hợp chất có công thức (XIX) với sự có mặt của chất xúc tác paladi trong môi trường bazơ.

Hợp chất có công thức (XIX) có thể được điều chế, ví dụ, theo cách tương tự các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2014/142292. Chất xúc tác paladi được sử dụng có thể là, ví dụ, [1,1'-bis-(diphenylphosphino)feroxen]diclopaladi(II). Thông thường các bazơ được sử dụng là bazơ vô cơ như kali tert-butoxit.

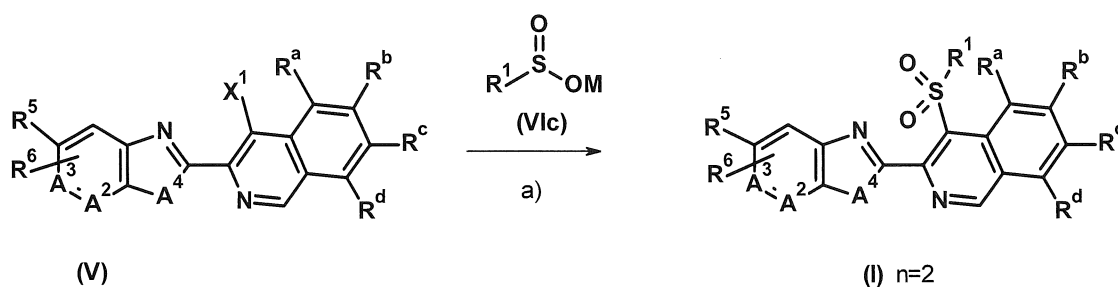
Phản ứng được thực hiện trong dung môi. Thông thường, toluen được sử dụng.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng. Tốt hơn, nếu phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ nằm trong khoảng từ 20 đến 110°C.

Việc chuyển hóa tiếp các hợp chất có công thức (V^{1-A}) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như quy trình A.

Quy trình F

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 và Q là Q1 đến Q9, Q16 và Q19 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, theo phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong các tài liệu WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 và WO2015/121136.



Các gốc R¹, R^a, R^b, R^c, R^d, R⁴, R⁵, R⁶, A² và A³ có nghĩa được xác định trên đây, A⁴ là O, S hoặc N-R⁴ và X¹ là halogen, tốt hơn brom hoặc iot.

Bước a)

Theo cách khác, các hợp chất có công thức (I) trong đó n bằng 2 cũng có thể được điều chế trong quy trình một bước, ví dụ, theo cách tương tự như quy trình được mô tả

trong tài liệu Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696-2700 bằng cách trao đổi halogen-sulfon với hợp chất có công thức (VIc) bắt đầu từ các hợp chất có công thức (V). Quá trình trao đổi này thường được thực hiện trong dung môi. Tốt hơn nếu sử dụng các dung môi phân cực không proton, ví dụ, dimetyl sulfoxit và N,N-dimetylformamit.

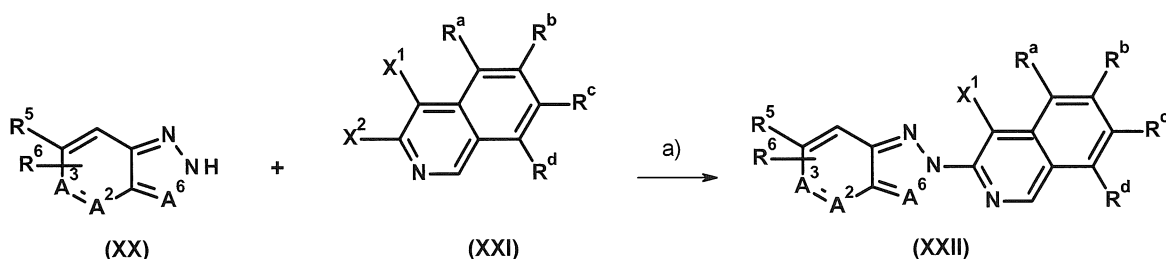
Các hợp chất có công thức (VIc) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, theo phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu Organic Synthesis 1977, 57, 88-92; Tetrahedron Letters 1979, 9, 821-824 và Bulletin de la Société Chimique de France 1958, 4, 447-450.

Các ví dụ về các chất phản ứng lưu huỳnh thích hợp là các muối lithi, natri hoặc kali của axit sulfonic.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Quy trình G

Các hợp chất có công thức (I) trong đó Q là Q12, Q13, Q17, Q18 hoặc Q20 có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, theo phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong các tài liệu WO2010/091310, WO 2012/66061 hoặc WO2013/099041.



Các gốc R^a , R^b , R^c , R^d , R^5 và R^6 có nghĩa được nêu ở trên. A^2 , A^3 và A^6 là CH hoặc N. X^1 và X^2 là halogen.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXII) có thể điều chế được bằng cách cho các hợp chất có công thức (XX) phản ứng với các hợp chất có công thức (XXI) trong điều kiện bazơ, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong WO2010/091310, WO 2012/66061, WO2013/099041 hoặc Tetrahedron 1993, 49, 10997-11008.

Các hợp chất có công thức (XX) có bán trên thị trường hoặc có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong tài liệu WO2005/100353, WO 2012/66061 hoặc trong tài liệu European Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214 - 2222.

Các hợp chất có công thức (XXI) 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 WO2013/43518, EP2168965 hoặc trong tài liệu Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 – 1455.

Các bazơ được sử dụng thường là bazơ vô cơ như natri hydrua, kali cacbonat hoặc xeri cacbonat.

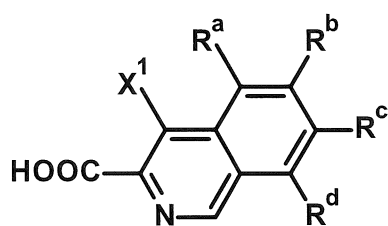
Quy trình chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XXII) thường được thực hiện trong dung môi, tốt hơn là trong nitril, ví dụ, axetonitril hoặc propionitril, hoặc trong dung môi phân cực không proton, ví dụ, N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Theo cách khác, phản ứng các hợp chất có công thức (XX) với các hợp chất có công thức (XXI) để tạo ra các hợp chất có công thức (XXII) cũng có thể được thực hiện bằng quá trình aryl hóa *N* được xúc tác bởi paladi, ví dụ, theo phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947.

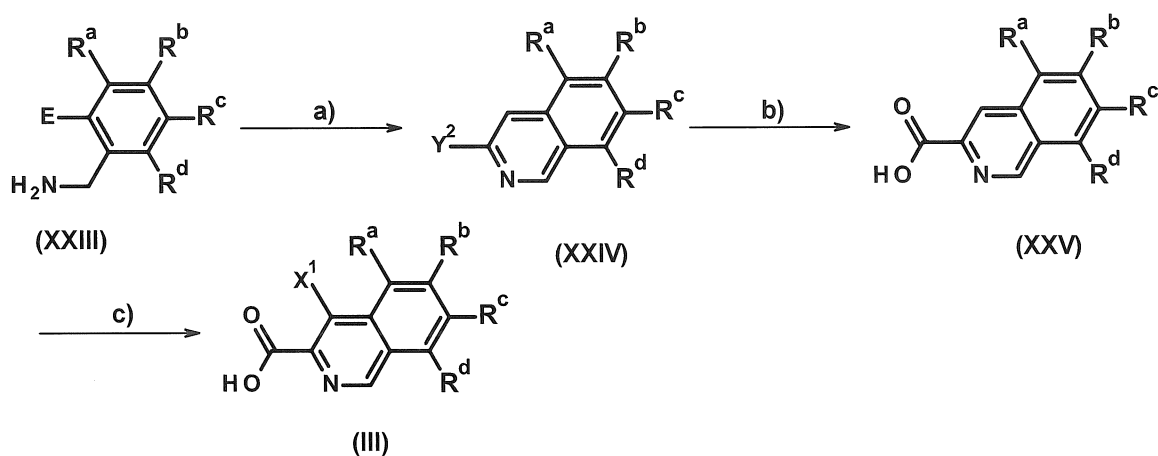
Việc chuyển hóa tiếp chất có công thức (XXII) thành các hợp chất có công thức (I) được thực hiện tương tự như quy trình A.

Quy trình H



(III)

Các axit carboxylic có công thức (III) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ từ benzylamin hoặc hetarylmetanamin theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Tetrahedron, 40 (1984), 311-314, Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684, Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181, WO2015/071178, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146.



Các gốc R^a , R^b , R^c và R^d có nghĩa được nêu ở trên. E là hydro hoặc halogen và X^1 là halogen. Y^2 là methyl, $C(O)OR^8$ hoặc xyano. R^8 là hydro hoặc C_1 - C_6 -alkyl.

Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXIV) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Tetrahedron, 40 (1984), 311-314 hoặc Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684 bằng cách ngưng tụ benzylamin hoặc hetarylmetanamin có công thức (XXIII) với các hợp chất carbonyl tương ứng trong điều kiện bazơ hoặc axit.

Các hợp chất có công thức (XXIII) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, chẳng hạn theo cách tương tự như các phương pháp được mô tả trong WO1997/41846; US2011/0105753; Journal of Medicinal Chemistry, 46 (2003), 461-473; WO2010/024430; WO2005/111003; Journal of Heterocyclic Chemistry, 23 (1986), 989-990.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XXV) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ bằng cách thủy phân các hợp chất có công thức (XXIV) (nếu $Y^2 = C(O)OR^8$ hoặc xyano) trong điều kiện bazơ, axit hoặc nhiệt độ.

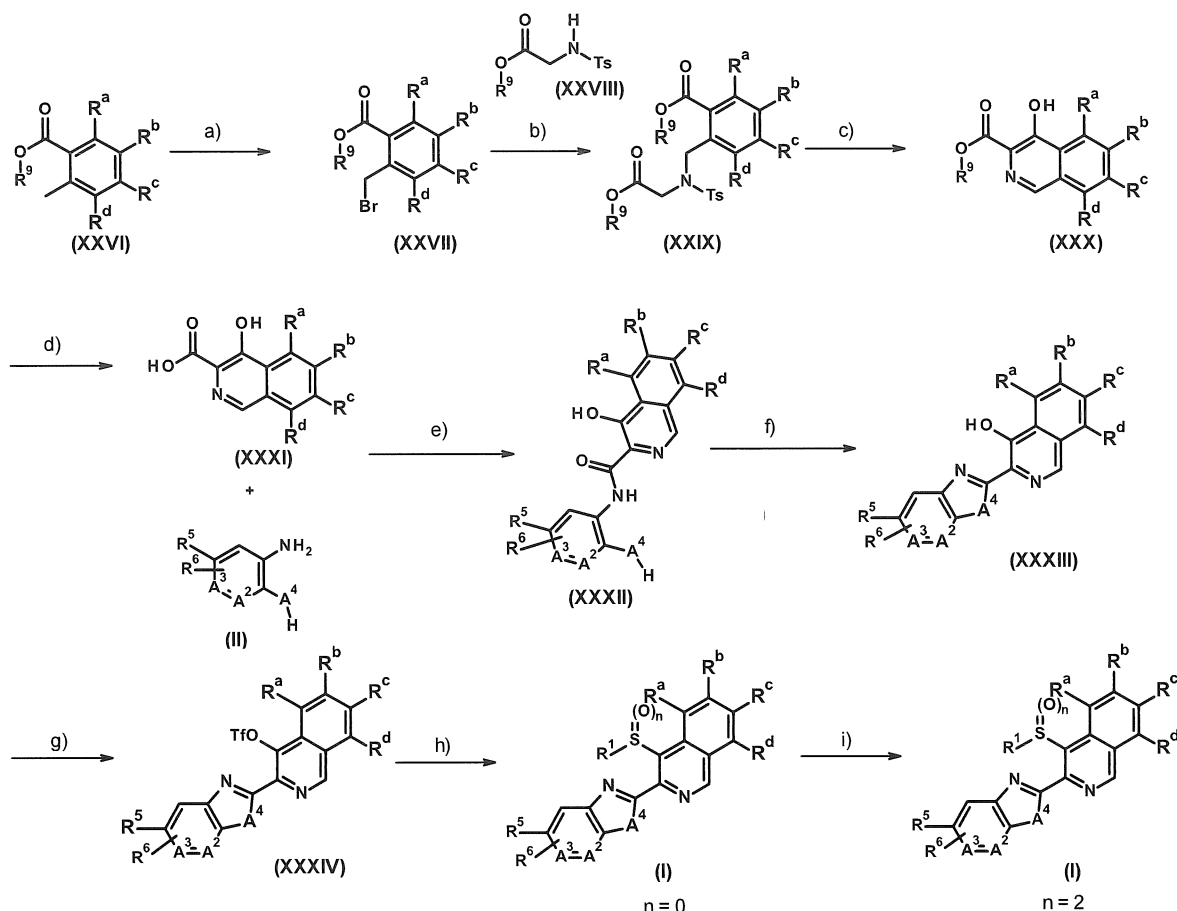
Các hợp chất có công thức (XXV) có thể được điều chế theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181 và WO2015/071178, bằng cách oxy hóa benzyl từ các hợp chất có công thức (XXIV) (nếu $Y^2 = \text{metyl}$).

Bước c)

Các hợp chất có công thức (III) có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết từ các hợp chất có công thức (XXV) bằng cách halogen hóa. Phản ứng này có thể được thực hiện, ví dụ, bằng cách ortho-lithi hóa trực tiếp, tiếp theo là bắt giữ carbanion bằng chất phản ứng halogen hóa ái điện tử thích hợp hoặc theo cách khác bằng các halogen hóa trực tiếp axit carboxylic theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 và WO2003/010146.

Quy trình I

Các hợp chất có công thức (I) trong đó R^1 , R^a , R^b , R^c , R^d , R^5 , R^6 , A^2 , A^3 và A^4 có nghĩa nêu trên và R^9 là (C₁-C₄)-alkyl, Tf là triflat (CF₃SO₂-) và Ts là tosylat (CH₃C₆H₄SO₂-) có thể được điều chế bằng các phương pháp đã biết, ví dụ, bằng quy trình được nêu dưới đây.



Bước a)

Các hợp chất có công thức (XXVII) có bán sẵn trên thị trường hoặc có thể được điều chế theo cách tương tự với các quy trình được mô tả trong Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2016, 26, 2526-2530 hoặc Tetrahedron Letters 2012, 53, 3654-3657 từ các hợp chất có công thức (XXVI) thông qua quá trình brom hóa gốc tự do.

Ví dụ, chất brom hóa được sử dụng có thể là N-bromosuccinimide. Các hợp chất azo như azoisobutyronitril (AIBN) hoặc peroxit như, ví dụ, dibenzoyl peroxit có thể được sử dụng làm chất khơi mào gốc.

Tốt hơn là dung môi được sử dụng là dung môi không proton, ví dụ như cacbon tetrachlorua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Hợp chất có công thức (XXVI) có bán trên thị trường.

Bước b)

Các hợp chất có công thức (XXIX) có thể được điều chế theo cách tương tự với quy trình được mô tả trong tài liệu WO2007/090068 bằng cách amin hóa sử dụng hợp chất có công thức (XXVIII) với sự có mặt của bazơ.

Các bazơ thích hợp là, ví dụ, các bazơ vô cơ như bazơ cacbonat. Dung môi được sử dụng có thể là dung môi phân cực không proton, ví dụ như N,N-dimetylformamit hoặc tetrahydrofuran.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Hợp chất có công thức (XXVIII) có bán trên thị trường.

Bước c)

Các hợp chất có công thức (XXX) có thể được điều chế theo cách tương tự với quy trình được mô tả trong tài liệu WO2007/090068 bằng cách đóng vòng các hợp chất có công thức (XXIX). Phản ứng có thể xảy ra với sự có mặt của bazơ; có thể sử dụng, ví dụ, các bazơ alkoxit như natri metoxit hoặc kali metoxit hoặc natri etoxit hoặc kali etoxit.

Dung môi thích hợp là dung môi proton, chẳng hạn như rượu mạch ngắn như metanol hoặc etanol.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Bước d)

Các hợp chất có công thức (XXXI) có thể được tổng hợp theo cách tương tự như các quy trình được mô tả trong Synthesis 1987, 6, 586-587, Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567 hoặc ChemMedChem 2010, 5, 65-78 bằng cách thủy phân từ các hợp chất có công thức (XXX).

Ví dụ về các bazơ thích hợp là, ví dụ, lithi hydroxit hoặc natri hydroxit. Các dung môi có thể được sử dụng là dung môi không proton và dung môi proton và hỗn hợp của chúng, ví dụ etanol, tetrahydrofuran hoặc nước.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C.

Bước e)

Các hợp chất có công thức (XXXII) có thể điều chế được bằng phản ứng của các hợp chất có công thức (II) với axit carboxylic có công thức (XXXI) với sự có mặt của tác nhân ngưng tụ hoặc bazơ.

Các hợp chất có công thức (II) có bán trên thị trường hoặc có thể điều chế được bằng các phương pháp đã biết, ví dụ các phương pháp tương tự như các quy trình được mô tả trong US2003/069257, US2012/0319050, WO2011/107998 hoặc WO2010/91310.

Phản ứng giữa các hợp chất có công thức (II) với các axit carboxylic có công thức (XXXI) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà tro trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan; hydrocacbon halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất chứa nitơ, ví dụ pyridin.

Các tác nhân ngưng tụ thích hợp là, ví dụ, carbodiimit như 1-(3-dimetylaminopropyl)-3-etylcarbodiimit hydroclorua (EDCI), 1,3-dixyclohexylcarbodiimit, thionyl clorua hoặc oxalyl clorua.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các bicarbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, đặc biệt ưu tiên natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri bicarbonat, kali bicarbonat. Các bazơ thích hợp khác là các hydrua của kim loại kiềm, ví dụ natri hydrua.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, tại áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng và ở nhiệt độ từ 0°C đến 180°C; tốt hơn phản ứng được thực hiện tại áp suất khí quyển và nhiệt độ từ 20 đến 140°C.

Bước f)

Các hợp chất có công thức (XXXIII) có thể điều chế được bằng cách ngưng tụ các hợp chất có công thức (XXXII) với cựa có mặt của bazơ.

Việc chuyển hóa thành các hợp chất có công thức (XXXIII) có thể được thực hiện nguyên chất hoặc trong dung môi, ưu tiên là thực hiện phản ứng này trong dung môi được chọn từ các dung môi thông thường mà trợ trong các điều kiện phản ứng phổ biến. Ưu tiên sử dụng các ete, ví dụ diisopropyl ete, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimetoxyetan, tert-butyl metyl ete; các hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ diclometan, cloroform, cacbon tetracloerua, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; các nitril, ví dụ axetonitril hoặc propionitril; các hydrocacbon thơm, ví dụ toluen hoặc xylen; các dung môi phân cực không proton, ví dụ N,N-dimetylformamit hoặc N-metylpyrrolidon, hoặc các hợp chất nitơ, ví dụ pyridin.

Các bazơ thích hợp là các bazơ vô cơ mà thường được sử dụng trong các phản ứng như vậy. Ưu tiên sử dụng các bazơ được chọn, ví dụ, từ nhóm gồm các axetat, các phosphat, các cacbonat và các bicarbonat của các kim loại kiềm hoặc các kim loại kiềm thổ. Ở đây, đặc biệt ưu tiên natri axetat, natri phosphat, kali phosphat, xesi cacbonat, natri cacbonat, kali cacbonat, natri bicarbonat, kali bicarbonat.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước g)

Các hợp chất có công thức (XXXIV) có thể được điều chế theo cách tương tự như quy trình được mô tả trong tài liệu WO2011/075630 từ các hợp chất có công thức (XXXIII) thông qua sự triflat hóa nhóm hydroxy với sự có mặt của chất hỗ trợ bazơ. Ví dụ, chất triflat hóa được sử dụng có thể là anhydrit triflometansulfonic.

Các bazơ hỗ trợ thích hợp là các bazơ amin như, ví dụ, bazơ trietylamin hoặc Hünig hoặc pyridin.

Phản ứng có thể được thực hiện với sự có mặt của dung môi phân cực không proton như, ví dụ, pyridin, diclometan hoặc tetrahydrofuran.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất tăng, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C.

Bước h)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0 có thể được điều chế theo cách tương tự với các quá trình được mô tả trong WO2013/161853 thông qua sự kết hợp C–S được xúc tác bằng kim loại chuyển tiếp từ các hợp chất có công thức (XXXIV).

Ví dụ, thích hợp để sử dụng làm chất xúc tác là các phức paladi như $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$. Thích hợp để sử dụng làm bazơ hỗ trợ, ví dụ, bazơ amin như triakylamin, hoặc bazơ vô cơ, ví dụ như bazơ cacbonat. Dung môi thích hợp là dung môi phân cực không proton, ví dụ như ete, tetrahydrofuran hoặc 1,4-dioxan.

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất khí quyển hoặc trong điều kiện áp suất cao, và ở nhiệt độ từ 0°C đến 200°C .

Bước i)

Các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 2 có thể được điều chế bằng cách oxy hóa các hợp chất có công thức (I) trong đó n là 0. Phản ứng oxy hóa này thường được thực hiện trong dung môi. Ưu tiên đối với hydrocacbon được halogen hóa, ví dụ, diclometan, clorofom, cacbon tetraclorea, 1,2-dicloetan hoặc clobenzen; rượu như metanol hoặc etanol; axit formic, axit axetic, axit propionic hoặc nước.

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

Phản ứng có thể được thực hiện trong điều kiện áp suất giảm thấp, ở áp suất chuẩn hoặc trong điều kiện áp suất tăng cao, và ở nhiệt độ từ -20°C đến 120°C .

Các phương pháp và 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 điều trị bằng phẫu thuật hoặc trị liệu cho cơ thể người hoặc động vật và phương pháp chẩn đoán được thực hiện trên cơ thể người hoặc động vật.

Sáng chế còn đề cập đến việc sử dụng các hợp chất có công thức (I) làm chất diệt sinh vật gây hại, đặc biệt là chế phẩm bảo vệ cây trồng.

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

Các hợp chất có công thức (I), có khả năng dung nạp tốt trên thực vật, không gây độc đối với động vật nội nhiệt và tương thích tốt với môi trường, thích hợp để bảo vệ thực vật và các cơ quan của thực vật chống lại các yếu tố bất lợi sinh học và phi sinh học, để làm tăng năng suất thu hoạch, để cải thiện chất lượng của vật liệu sau thu hoạch và để phòng trừ động vật gây hại, nhất là côn trùng, động vật thuộc lớp nhện, giun sán, đặc biệt là giun tròn và động vật thân mềm, các loại này thường gặp trong nông nghiệp, trong làm vườn, trong chăn nuôi, trong nuôi trồng thủy sản, trong trồng rừng, trong các khu vườn và cơ sở giải trí, trong bảo vệ sản phẩm và vật liệu lưu kho, và trong khu 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 trị liệu 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 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 nhạy 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 từ lớp nhện (Arachnida), ví dụ *Acarus* spp., ví dụ *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., ví dụ *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., ví dụ *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., ví dụ *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., ví dụ *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., ví dụ *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., ví dụ *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphersa* spp., *Oligonychus* spp., ví dụ *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., ví dụ *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., ví dụ *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., ví dụ *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestani*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

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

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

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

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

thuộc bộ cánh cứng (Coleoptera), ví dụ *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus* spp., ví dụ *Agrilus planipennis*, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp., ví dụ *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., ví dụ *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., ví dụ *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., ví dụ *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., ví dụ *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., ví dụ *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., ví dụ *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., ví dụ *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra 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 adpersus*, *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*, *Diloboderus* 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 psyllodes*, *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*, *Lasioderma serricorne*,

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

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

thuộc bộ hai cánh (Diptera), ví dụ *Aedes* spp., ví dụ *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., ví dụ *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., ví dụ *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., ví dụ *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *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., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., ví dụ *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., ví dụ *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., ví dụ *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* oder *Pegomyia* spp., ví dụ *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilina casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., ví dụ *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., ví dụ *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., ví dụ *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

thuộc bộ cánh nửa (Hemiptera), ví dụ *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., ví dụ *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *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 hederarum*, *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, Cocomytilus 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 lillii, 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., Nephrotettix spp., ví dụ Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix 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 pyriiformis, 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*, *Leptocorisa* spp., *Leptocorisa varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., ví dụ *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., ví dụ *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Megacopta cribraria*, *Miridae*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., ví dụ *Nezara viridula*, *Nysius* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., ví dụ *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

từ bộ cánh màng (Hymenoptera), ví dụ *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., ví dụ *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., ví dụ *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., ví dụ *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema* (*Iridiomyrmex*) *humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., ví dụ *Sirex noctilio*, *Solenopsis*

invicta, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocerus* spp., *Vespa* spp., ví dụ *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

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

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

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

Lyonetia clerkella, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphis* 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 *ni*, *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*;

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

từ 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;

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

từ lớp rết tơ (Symphyla), ví dụ, Scutigerella spp., ví dụ, Scutigerella immaculata;

các sinh vật gây hại từ ngành thân mềm (Mollusca), ví dụ, từ lớp Bivalvia, ví dụ, Dreissena spp.;

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

các sinh vật gây hại thực vật thuộc ngành giun tròn (Nematoda), tức là 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., Globodera spp., ví dụ Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., ví dụ Helicotylenchus dihystra, Hemicriconemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., ví dụ Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hirschmaniella spp., Hoplolaimus spp., Longidorus spp., ví dụ Longidorus africanus, Meloidogyne spp., ví dụ Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., ví dụ Paratrichodorus minor, Paratylenchus

spp., *Pratylenchus* spp., ví dụ *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., ví dụ *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., ví dụ *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., ví dụ *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., ví dụ *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., ví dụ *Xiphinema index*.

Các hợp chất có công thức (I), ở nồng độ hoặc tỷ lệ áp dụng nhất định, nếu có, cũng có thể được sử dụng làm chất diệt cỏ, chất an toàn, chất điều hòa sinh trưởng hoặc các 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, metyl este của dầu hạt cải hoặc metyl este của dầu đậu nành, hoặc alkanol alkoxylat và/hoặc chất phân tán, ví dụ, alkylsiloxan và/hoặc các muối, ví dụ, các muối amoni hoặc phosphoni hữu cơ hoặc vô cơ, ví dụ, amoni sulfat hoặc diamoni hydrophosphat và/hoặc chất tăng cường khả năng lưu giữ, ví dụ, dioctyl sulfosuccinat hoặc polyme hydroxypropylguar và/hoặc chất giữ ẩm, ví dụ, glyxerol và/hoặc phân bón, ví dụ, phân bón chứa amoni, kali hoặc phospho.

Các chế phẩm thông thường là, ví dụ, chất lỏng hòa tan trong nước (SL), nhũ tương đặc (EC), nhũ tương trong nước (EW), huyền phù đặc (SC, SE, FS, OD), hạt dễ phân tán trong nước (WG), hạt (GR) và chế phẩm đặc đóng nang (CS); các chế phẩm này và các loại chế phẩm có thể khác được mô tả, ví dụ, bởi Crop Life International và trong tài liệu Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and

WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, được soạn bởi FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Các chế phẩm, ngoài một hoặc nhiều các hợp chất có công thức (I), tùy ý bao gồm thêm các thành phần có hoạt tính hóa nông.

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

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

Các chất phụ trợ được sử dụng có thể là các chất thích hợp để mang lại các đặc tính đặc biệt, như các đặc tính vật lý, kỹ thuật và/hoặc sinh học nhất định, cho chế phẩm chứa các hợp chất có công thức (I), hoặc cho dạng sử dụng được bào chế từ các chế phẩm này (ví dụ, chất diệt sinh vật gây hại dùng ngay như dung dịch phun hoặc sản phẩm xử lý hạt).

Các chất độn thích hợp là, ví dụ, nước, 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, ete 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 xylene, 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. Các chất mang hữu dụng chủ yếu bao gồm, ví dụ, các muối amoni và đá nghiền mịn tự nhiên như cao lanh, các alumin, bột talc, đá phấn, thạch anh, atapulgit, monmorilonit hoặc đất diatomit, và các đá nghiền mịn tổng hợp như silic dioxit phân tán, nhôm oxit và các silicat tự nhiên hoặc tổng hợp, các 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. Chất độn hoặc chất mang đặc biệt thích hợp là các chất ở trạng thái khí ở nhiệt độ tiêu chuẩn và dưới áp suất khí quyển, ví dụ, chất đẩy sol khí như hydrocacbon được halogen hóa, và cả butan, propan, nitơ và cacbon dioxit.

Ví dụ về 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 quang, hoặc các chất khác giúp cải thiện độ ổn định hóa học và/hoặc vật lý. Các chất tạo bọt hoặc các chất chống tạo bọt cũng có thể có mặt.

Ngoài ra, các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này cũng có thể chứa, dưới dạng chất phụ trợ bổ sung, chất kết dính như carboxymethylxenluloza và các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt hoặc latec, như gôm arabic, rượu polyvinyl và polyvinyl axetat, hoặc còn các phospholipit tự nhiên như xephalin và lexithin và các phospholipit tổng hợp. Các chất phụ trợ khác có thể là dầu khoáng và dầu thực vật.

Nếu thích hợp, các chất phụ trợ khác cũng có thể có mặt trong các chế phẩm và các dạng sử dụng thu được từ các chế phẩm này. Ví dụ về các chất phụ gia như vậy là chất tạo hương, chất keo bảo vệ, chất kết dính, chất bám dính, chất làm đặc, chất xúc biến, chất xuyên thấm, chất tăng cường khả năng lưu giữ, chất làm ổn định, chất càngh 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 nhuyễn 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 tin 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 đồng phân khác nhau, thì các dạng này cũng được bao gồm ngay cả khi không được nêu một cách rõ ràng trong mỗi trường hợp. Tất cả các thành phần phối trộn được đề cập, trong trường hợp có thể, cũng có thể tạo ra muối với các bazơ hoặc axit thích hợp nếu chúng có khả năng như vậy dựa trên các nhóm chức của chúng.

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

Các hoạt chất được xác định 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 được tra cứu trên Internet (ví dụ, tại địa chỉ <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, dimethylvinphos, 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, oxytmeton-metyl, parathion-metyl, phenthoat, phorat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclofon và vamidothion.

(2) Các chất phong bế kênh clorua đóng mở cổng bởi GABA, 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 pyrethroit được chọn từ acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, chất đồng phân bioallethrin S-xyclopentenyl, bioresmethrin, xycloprothrin, 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, momflothrin, 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 acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid và thiamethoxam, hoặc nicotin, hoặc các sulfoximin được chọn từ sulfoxaflor, hoặc các butenolid được chọn từ flupyradifuron, hoặc các mesoionic được chọn từ triflumezopyrim.

(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 clorua channel - GluCl), tốt hơn là các avermectin/các milbemycin được chọn từ abamectin, emamectin benzoat, lepimectin và milbemectin.

(7) Các chất bắt chước hormon 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* subspecies *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *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 azoxyclostin, 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 sự sinh tổng hợp chitin, loại 0, được chọn từ bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluxyclozuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron và triflumuron.

(16) Các chất ức chế sự 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 tetrone và axit tetramic được chọn từ spirotetramat, spirotetramat, spiromesifen và spirotetramat.

(24) Các chất ức chế vận chuyển điện tử phức IV 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 xyanua và natri xyanua.

(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, benclothiaz, benzoximate, benzpyrimoxan, bifenazate, broflanilide, bromopropylate, chinomethionat, cloprallethrin, cryolite, cyclaniliprole, xyclozaprid, cyhalodiamide, dicloromezotiaz, dicofol, dimpropyridaz, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoquin, fluazaindolizine, fluensulfone, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprole, fluhexafon, fluopyram, flupyrimin, fluralaner, fluxametamide, fufenozide, guadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodion, kappa bifenthrin, isoxycloseram, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, oxazosulfyl, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spiobudiclofen, spiopidion, tetrametylfluthrin, tetraniliprole, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximat 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 từ WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]-5-flospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-yl}(2-clopyridin-4-yl)metanon (đã biết từ WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-clo-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clophenyl)prop-2-en-1-yl]piperidin-4-yl}-4-(triflometyl)phenyl]isonicotinamit (đã biết từ WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-clo-2,6-dimetylphenyl)-4-hydroxy-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (đã biết từ 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 từ EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-yn-1-yloxy)-6-(3,5-dimetyl-piperidin-1-yl)-5-flopyrimidin (đã biết từ WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (đã biết từ 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 WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(benzylcarbamoil)-4-clophenyl]-1-metyl-3-(pentaflloetyl)-4-(triflometyl)-1H-pyrazol-5-carboxamit (đã biết

trong tài liệu WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-clo-N-[4-clo-2-metyl-6-(metylcarbamoyl)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 xyclopropancarboxylic (đã biết trong tài liệu CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metyl este của axit (4aS)-7-clo-2,5-dihydro-2-[[[(metoxycarbonyl)[4-[(triflometyl)thio]phenyl]amino]carbonyl]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H)-carboxylic (đã biết trong tài liệu CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxy-3-O-etyl-2,4-di-O-metyl-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoetoxy)phenyl]-1H-1,2,4-

triazol-3-yl]phenyl]carbamate]- α -L-mannopyranose (đã biết trong tài liệu US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-xylopropylmethoxy-4-trifluoromethylphenoxy)-3-(6-trifluoromethylpyridazin-3-yl)-3-azabicyclo[3,2,1]octan (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-xylopropylmethoxy-4-trifluoromethylphenoxy)-3-(6-trifluoromethylpyridazin-3-yl)-3-azabicyclo[3,2,1]octan (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-xylopropylmethoxy-4-trifluoromethylphenoxy)-3-(6-trifluoromethylpyridazin-3-yl)-3-azabicyclo[3,2,1]octan (đã biết trong tài liệu WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-chloro-3-(3-pyridinyl)-1H-pyrazol-4-yl]-N-ethyl-3-[(3,3,3-trifluoropropyl)thio]propanamide (đã biết trong tài liệu WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) và N-[4-(aminothioxomethyl)-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-3-bromo-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-1H-pyrazol-5-carboxamide (đã biết trong tài liệu CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-yl)-4-[[4-(trifluoromethyl)phenyl]methoxy]pyrimidin (đã biết trong tài liệu WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-chloro-2,6-dimethylphenyl)-8-methoxy-1-methyl-1,8-diazaspiro[4.5]decan-2,4-dione (đã biết trong tài liệu WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), ethyl 3-(4-chloro-2,6-dimethylphenyl)-8-methoxy-1-methyl-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-carboxylate (đã biết trong tài liệu WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), 4-[(5S)-5-(3,5-dichloro-4-fluorophenyl)-4,5-dihydro-5-(trifluoromethyl)-3-isoxazolyl]-N-[(4R)-2-ethyl-3-oxo-4-isoxazolidinyl]-2-methylbenzamide (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 tra cứu được 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), trong trường hợp có thể, có thể bao gồm các dạng hỗn hợp.

1) Các chất ức chế sinh tổng hợp ergosterol, ví dụ (1.001) cyproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (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)xylopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xylopentanol, (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-metyl-1,3-dioxolan-2-yl}metyl)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.040) 1-{{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-ylthioxyanat, (1.041) 1-{{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol-5-yl thioxyanat, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-

yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.050) 2-[1-(2,4-diclophenyl)-5-hydroxy-2,6,6-trimetylheptan-4-yl]-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.051) 2-[2-clo-4-(2,4-diclophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-clo-4-(4-clophenoxy)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clophenoxy)-2-(triflometyl)phenyl]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)propan-2-ol, (1.056) 2-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion, (1.059) 5-(4-clobenzyl)-2-(clometyl)-2-metyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmetyl)xcyclopentanol, (1.060) 5-(allylsulfanyl)-1-{[3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(allylsulfanyl)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clophenyl)-2-(2,4-diflophenyl)oxiran-2-yl]metyl}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.064) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,2-trifloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.065) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflopropoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.066) N'-(2,5-dimetyl-4-{[3-(pentafloetoxy)phenyl]sulfanyl}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.067) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.068) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,2-trifloetyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.069) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(2,2,3,3-tetraflopropyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-

metylimidoformamit, (1.070) N'-(2,5-dimetyl-4-{3-[(pentafluoretyl)sulfanyl]phenoxy}phenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.071) N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.072) N'-(4-{[3-(difluoromethoxy)phenyl]sulfanyl}-2,5-dimetylphenyl)-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.073) N'-(4-{3-[(difluoromethyl)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-dichloro-1,3-thiazol-2-yl)oxy]-2,5-dimetylphenyl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.076) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorophenyl)ethoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.077) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorophenyl)ethoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.078) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropylcyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropylcyclohexyl)oxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.080) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-difluorophenyl)ethoxy]-2-metylpyridin-3-yl}-N-etyl-N-metylimidoformamit, (1.081) ipfentrifluconazol.

2) Các 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 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) sedaxan, (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-(trifluoromethyl)-N-[2'-(trifluoromethyl)biphenyl-2-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.026) 2-fluor-6-(trifluoromethyl)-N-(1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)benzamid, (2.027) 3-(difluoromethyl)-1-metyl-N-(1,1,3-trimetyl-

2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.028) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.029) 3-(diflometyl)-1-metyl-N-[(3S)-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.030) 3-(diflometyl)-N-(7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.031) 3-(diflometyl)-N-[(3R)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.032) 3-(diflometyl)-N-[(3S)-7-flo-1,1,3-trimetyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl]-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.033) 5,8-diflo-N-[2-(2-flo-4-{[4-(triflometyl)pyridin-2-yl]oxy}phenyl)etyl]quinazolin-4-amin, (2.034) N-(2-xyclopentyl-5-flobenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.035) N-(2-tert-butyl-5-metylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.036) N-(2-tert-butylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.037) N-(5-clo-2-etylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.038) N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclometylen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaphtalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.041) N-[1-(2,4-diclophenyl)-1-metoxipropan-2-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.042) N-[2-clo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.043) N-[3-clo-2-flo-6-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.044) N-[5-clo-2-(triflometyl)benzyl]-N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.045) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-N-[5-metyl-2-(triflometyl)benzyl]-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.046) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-flo-6-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.047) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropyl-5-metylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.048) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carbothioamit, (2.049) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.050) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-flo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit,

(2.051) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-4,5-dimetylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.052) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-flobenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.053) N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-N-(2-etyl-5-metylbenzyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.054) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-flobenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.055) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropyl-5-metylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.056) N-xyclopropyl-N-(2-xyclopropylbenzyl)-3-(diflometyl)-5-flo-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamit, (2.057) pyrapropoyn.

3) Các chất ức chế chuỗi hô hấp ở phức III, ví dụ (3.001) ametotradin, (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-dimetylpent-3-enamit, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-benzyl-3-[(3-{[(isobutyryloxy)metoxy]-4-metoxypyridin-2-yl}carbonyl)amino]-6-metyl-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-yl 2-metylpropanoat, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl}-2-metoxi-N-metylaxetamit, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetylxclohexyl)-3-formamido-2-hydroxybenzamit, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clo-2-flophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy}-2-(metoxyimino)-N,3-dimetylpent-3-enamit, (3.029) metyl {5-[3-(2,4-dimetylphenyl)-1H-pyrazol-1-yl]-2-metylbenzyl} carbamat, (3.030) metyltetraprol, (3.031) florylpicoxamid.

4) Các chất ức chế nguyên phân và phân chia tế bào, ví dụ (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolide, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazole, (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 (5.01) hỗn hợp Bordeaux, (5.02) captafol, (5.03) captan, (5.04) clothalonil, (5.05) đồng hydroxit, (5.06) đồng naphtenat, (5.07) đồng oxit, (5.08) đồng oxyclorea, (5.09) đồng(2+) sulfat, (5.10) dithianon, (5.011) dodine, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram kẽm, (5.017) oxine-đồng, (5.018) propineb, (5.019) lưu huỳnh và chế phẩm chứa lưu huỳnh bao gồm canxi polysulfua, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etyl-5,7-dioxo-6,7-dihydro-5H-pyrol[3',4':5,6][1,4]dithiino[2,3-c][1,2]thiazol-3-carbonitril.

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

7) Các chất ức chế sinh tổng hợp axit amin và/hoặc protein, ví dụ (7.001) cyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) kasugamycin hydroclorua hydrat, (7.004) oxytetracyclin, (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) Các chất ức chế tổng hợp vách tế bào, ví dụ (9.001) benthiavalicarb, (9.002) Benthiavalicarb-isopropyl, (9.003) dimethomorph, (9.004) flumorph, (9.005) iprovalicarb, (9.006) mandipropamid, (9.007) pyrimorph, (9.008) valifenalat, (9.009) (2E)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on, (9.010) (2Z)-3-(4-tert-butylphenyl)-3-(2-clopyridin-4-yl)-1-(morpholin-4-yl)prop-2-en-1-on.

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

11) Các 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} carbamat.

12) Các 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) Các chất ức chế 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 hoạt động dưới dạng chất phân tách, ví dụ, (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.

15) Các hợp chất khác, ví dụ (15.001) axit Absciscic, (15.002) benthiazole, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvon, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15,008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15,010) xyprosulfamit, (15.011) flutianil, (15.012) fosetyl-nhôm, (15.013) fosetyl-canxi, (15.014) fosetyl-natri, (15.015) metyl isothiocyxanat, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomyacin, (15.018) natamycin, (15.019) nicken dimetyldithiocarbamat, (15.020) nitrothal-isopropyl, (15.021) oxamocarb, (15.022) Oxathiapirolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclophenol và muối, (15.025) axit phosphonic và muối của nó, (15.026) propamocarb-fosetyl, (15,027) pyriofenon (chlazafenon) (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanit, (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]ethanon, (15,032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl]-1,3-thiazol-2-yl}piperidin-1-yl)-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanon, (15,033) 2-(6-benzylpyridin-2-yl)quinazolin, (15.034) 2,6-

dimetyl-1H,5H-[1,4]dithiino[2,3-c:5,6-c']dipyrrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetron, (15.035) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.036) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-clo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.037) 2-[3,5-bis(diflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]-1-[4-(4-{5-[2-flo-6-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]-4,5-dihydro-1,2-oxazol-3-yl}-1,3-thiazol-2-yl)piperidin-1-yl]etanon, (15.038) 2-[6-(3-flo-4-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 muối của nó, (15.046) 3-(4,4,5-triflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.047) 3-(4,4-diflo-3,3-dimetyl-3,4-dihydroisoquinolin-1-yl)quinolin, (15.048) 4-amino-5-flopyrimidin-2-ol (dạng tautome: 4-amino-5-flopyrimidin-2(1H)-on), (15.049) axit 4-oxo-4-[(2-phenyletyl)amino]butanoic, (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-benzoxazepine, (15.055) but-3-yn-1-yl {6-[(1-metyl-1H-tetrazol-5-yl)(phenyl)metylen]amino}oxy)metylpyridin-2-yl}cacbamat, (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)metylpyridin-2-yl}cacbamat, (15.062) 5-flo-4-imino-

3-metyl-1-[(4-metylphenyl)sulfonyl]-3,4-dihydropyrimidin-2(1H)-on, (15.063)
aminopyrifen.

Các 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 các chất diệt sinh vật gây hại sinh học.

Chất diệt sinh vật gây hại sinh học đặc biệt bao gồm vi khuẩn, nấm, nấm men, chiết phẩm từ thực vật và các sản phẩm được tạo ra bởi các vi sinh vật, bao gồm protein và các sản phẩm chuyển hóa thứ cấp.

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

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

Bacillus amyloliquefaciens, chủng FZB42 (DSM 231179), hoặc *Bacillus cereus*, đặc biệt là *B. cereus* chủng CNCM I-1562 hoặc *Bacillus firmus*, chủng I-1582 (Số nộp lưu CNCM I-1582) hoặc *Bacillus pumilus*, đặc biệt là chủng GB34 (Số nộp lưu ATCC 700814) và chủng QST2808 (Số nộp lưu NRRL B-30087), hoặc *Bacillus subtilis*, đặc biệt là chủng GB03 (Số nộp lưu ATCC SD-1397), hoặc *Bacillus subtilis* chủng QST713 (Số nộp lưu NRRL B-21661) hoặc *Bacillus subtilis* chủng OST 30002 (Số nộp lưu NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, đặc biệt là *B. thuringiensis* loài phụ *israelensis* (kiểu huyết thanh H-14), chủng AM65-52 (Số nộp lưu ATCC 1276), hoặc *B. thuringiensis subsp. aizawai*, đặc biệt là chủng ABTS-1857 (SD-1372), hoặc *B. thuringiensis subsp. kurstaki* chủng HD-1, hoặc *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* chủng NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (*Rotylenchulus reniformis* nematode)-PR3 (Số nộp lưu ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* chủng AQ6121 (= QRD 31,013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* chủng AQ 6047 (Số nộp lưu NRRL 30232).

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

Beauveria bassiana, cụ thể là chủng ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, cụ

thể là chủng CON/M/91-8 (mã số truy cập số DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, cụ thể là chủng HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii* (trước đây được biết đến 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* (mới: *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.*, đặc biệt là *Burkholderia cepacia* (trước đây được biết là *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, hoặc *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, đặc biệt là *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

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

Allium sativum, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, Cassia

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

Chất an toàn làm thành phần phối trộn

Các hợp chất có công thức (I) có thể được kết hợp với các chất an toàn, ví dụ, benoxacor, cloquintocet (-mexyl), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenchlorazol (-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 gạo, tiểu hắc mạch, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch), ngô, đậu tương, khoai tây, củ cải đường, mía đường, cà chua, đậu và các loại rau khác, bông, thuốc lá, cải 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 gạo, khoai tây, bông, mía đường, thuốc lá và cải dầu. Các đặc tính ("tính trạng") đặc biệt được nhấn mạnh là tăng tính kháng của thực vật chống lại côn trùng, nhện, giun tròn và ốc sên và ốc.

Bảo vệ cây trồng – các kiểu xử lý

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

công thức (I) bằng phương pháp thể tích cực nhỏ hoặc bơm dạng ứng dụng hoặc chính hợp chất có công thức (I) vào trong đất.

Cách xử lý thực vật trực tiếp được ưu tiên là đưa lên lá, có nghĩa là, hợp chất có công thức (I) được đưa lên 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 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.

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để bảo vệ hạt giống thực vật bất kỳ được sử dụng trong nông nghiệp, trong nhà kính, trong trồng rừng hoặc trong làm vườn. Cụ thể hơn, đó là hạt ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, kê và yến mạch), ngô, bông, đậu tương, lúa, khoai tây, hướng dương, cà phê, thuốc lá, cải dầu 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, cải dầu canola, 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 thuringiensis*.

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

hạt mà đã được ngâm, ví dụ, trong nước đến khi đạt đến giai đoạn mầm lúa nhất định (“giai đoạn ức bờ câu”) mà kích thích khả năng nảy mầm và khả năng mọc đồng đều hơn.

Khi xử lý hạt, cần phải cẩn thận ở chỗ, lượng hợp chất có công thức (I) được đưa lên hạt và/hoặc lượng các chất phụ gia khác được chọn theo cách sao cho sự nảy mầm của hạt không bị ảnh hưởng bất lợi, hoặc sao cho cây thu được không bị thương tổn. Điều này cần phải được bảo đảm, 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 hóa thành các chế phẩm xử lý hạt thông thường, như dung dịch, nhũ tương, huyền phù, bột, bột, huyền phù đặc hoặc các chế phẩm phủ khác dùng cho hạt và cả các chế phẩm ULV.

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

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

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

Chất phân tán và/hoặc chất nhũ hóa thích hợp mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất phân tán không ion, anion và cation thường dùng trong phối chế các hoạt chất hóa nông. Các chất phân tán không ion hoặc anion hoặc hỗn hợp các chất phân tán không ion hoặc anion có thể được ưu tiên sử dụng.

Các chất phân tán không ion thích hợp bao gồm đặc biệt là các polyme khối etylen oxit/propylen oxit, alkylphenol polyglycol ete và tristyrylphenol polyglycol ete, và các dẫn xuất được phosphat hóa hoặc sulfat hóa của chúng. Các chất phân tán anion thích hợp đặc biệt là các lignosulfonat, các muối của axit polyacrylic và sản phẩm ngưng tụ arylsulfonat-formaldehyt.

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

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

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

Các chất kết dính hữu ích mà có thể có mặt trong chế phẩm xử lý hạt dùng được theo sáng chế là tất cả các chất kết dính thông thường có thể sử dụng trong các sản phẩm xử lý hạt. Các ví dụ ưu tiên bao gồm polyvinylpyrrolidon, polyvinyl axetat, rượu polyvinyllic và tyloza.

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

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

xử lý hạt dùng được theo sáng chế, hoặc dạng sử dụng 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 kilogam hạt, tốt hơn từ 0,01 đến 15 g trên kilogam hạt.

Sức khỏe của động vật

Trong lĩnh vực sức khỏe động vật, tức lĩnh vực thuốc thú y, hợp chất có công thức (I) có hoạt tính chống lại các sinh vật ký sinh trên động vật, đặc biệt là sinh vật ngoại ký sinh hoặc sinh vật nội ký sinh. Thuật ngữ "sinh vật nội ký sinh" bao gồm đặc biệt là giun sán và động vật nguyên sinh, như cầu trùng coccidia. Sinh vật ngoại ký sinh điển hình và tốt hơn là 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, đama 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,

từ bộ chấy rận (Anoplurida), ví dụ *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.;

từ 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.;

từ bộ Diptera và phân bộ Nematocerina và Brachycerina, ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Atylotus* spp., *Braula* spp., *Calliphora* spp., *Chrysomyia* spp., *Chrysops* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Eusimulium* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematobia* spp., *Haematopota* spp., *Hippobosca* spp., *Hybomitra* spp., *Hydrotaea* spp., *Hypoderma* spp., *Lipoptena* spp., *Lucilia* spp., *Lutzomyia* spp., *Melophagus* spp., *Morellia* spp., *Musca* spp., *Odagmia* spp., *Oestrus* spp., *Philipomyia*

spp., Phlebotomus spp., Rhinoceros spp., Sarcophaga spp., Simulium spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tipula spp., Wilhelmia spp., Wohlfahrtia spp.;

thuộc bộ Siphonapterida, ví dụ, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., Pulex spp., Tunga spp., Xenopsylla spp.;

từ bộ 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 từ bộ Blattaria.

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:

từ phân lớp Acari (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); từ bộ Mesostigmata như Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Sternostoma spp., Tropilaelaps spp., Varroa spp.; từ bộ Actiniedida (Prostigmata), ví dụ, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Demodex spp., Listerophorus spp., Myobia spp., Neotrombicula spp., Ornithocheyletiella spp., Psorergates spp., Trombicula spp.; và từ bộ Acaridida (Astigmata), ví dụ, Acarus spp., Caloglyphus spp., Chorioptes spp., Cyrtodites 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 Hartmannella sp.

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

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

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

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

Monogenea: ví dụ *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Troglocephalus* spp.;

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

Từ 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., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.

Sán lá: thuộc lớp *Digenea*, ví dụ: *Austrobilharzia* 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., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp.,

Posthodiplostomum spp., Prosthogonimus spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Troglotrema spp., Typhlocoelum spp.

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

từ bộ Tylenchida, ví dụ: Micronema spp., Parastrongyloides spp., Strongyloides spp.

Thuộc bộ Rhabditina, ví dụ: Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Bronchonema spp., Bunostomum spp., Chabertia spp., Cooperia spp., Cooperioides spp., Crenosoma spp., Cyathostomum spp., xyclococercus spp., xyclodontostomum spp., Cylicocyclus spp., Cylicostephanus spp., Cyndropharynx 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., Neostongylus spp., Nippostrongylus spp., Obeliscoides spp., Oesophagodontus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp.; Ornithostrongylus spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Paracooperia spp., Paracrenosoma spp., Parastrongyloides spp., Parelaphostrongylus spp., Pneumocaulus spp., Pneumostongylus spp., Poteriostomum spp., Protostrongylus spp., Spicocaulus spp., Stephanurus spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Teladorsagia spp., Trichonema spp., Trichostrongylus spp., Triodontophorus spp., Troglostongylus 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., Parastrongyloides 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 chống giun sán, đặc biệt là làm chất diệt giun tròn, chất diệt giun dẹp, chất diệt động vật đầu móc hoặc chất diệt động vật năm giác.

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

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

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

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

được dụng thường dùng trong các chế phẩm thú y và/hoặc chất phụ trợ thường dùng trong các chế phẩm thú y.

Theo các khía cạnh khác, sáng chế đề cập đến các chế phẩm thú y được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt sinh vật ngoại ký sinh và diệt sinh vật nội ký sinh, đặc biệt được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun sán, diệt động vật nguyên sinh và diệt động vật chân khớp, rất đặc biệt là được chọn từ nhóm gồm chế phẩm diệt giun tròn, diệt giun 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 này, 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 axetylcholin 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 axetylcholin 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 fentrifanil, fenoxacrim, xyclopren, clobenzilat, 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, flubrocylthrinat, fubfenprox, fenfluthrin, protrifenbut, pyresmethrin, RU15525, terallethrin, cis-resmethrin, heptafluthrin, bioetanomethrin, biopermethrin, fenpyrithrin, cis-cypermethrin, cis-permethrin, clocythrín, cyhalothrin (lambda-), 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 benzoat; milbemycin oxime

tripren, epofenonan, diofenolan;

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

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

benzoylure, ví dụ fluazuron, penfluron,

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

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

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

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

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, thiophanat, parabendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, thiabendazol, xyclobendazole, 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, brotianit, clioxanit, closantel, niclosamit, oxyclozanit, rafoxanit;

từ nhóm phenol được thế, ví dụ: nitroxynil, bithionol, disophenol, hexaclophen, 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;

thuộc nhóm piperazin, ví dụ: piperazin, hydroxyzin;

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

từ các nhóm khác, ví dụ: bunamidin, niridazol, resorantel, omphalotin, oltipraz, nitroscanat, nitroxynil, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanthon, hycanthon, 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 polyete ionophore, 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 sulfonamid, ví dụ: sulfaquinoxalin, trimetoprim, sulfaclozin;

thuộc nhóm thiamin, ví dụ: amprolium;

thuộc nhóm lincosamid, ví dụ: clindamycin;

thuộc nhóm carbanilit, ví dụ: imidocarb;

từ nhóm nitrofur, ví dụ: nifurtimox;

thuộc nhóm quinazolinon alkaloit, 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 vào vật chủ (ví dụ, ký sinh trùng sốt rét do muỗi).

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

1) Muỗi

- Anopheles: 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 tích đốt (tick-borne encephalitis - TBE), sốt xuất huyết Crimean–Congo, bệnh do xoắn khuẩn borrelia;

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

Ví dụ về các vật truyền trong ngữ cảnh của sáng chế là côn trùng, ví dụ rệp, ruồi, rầy hoặc bọ trĩ, các vật truyền này có thể truyền virus thực vật sang thực vật. Các vật

truyền khác có khả năng truyền virus thực vật là nhện đỏ, chấy rận, bọ cánh cứng và giun tròn.

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

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

Hợp chất có công thức (I) thích hợp để sử dụng trong 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.

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

Xác định phân tích

Các phương pháp xác định phân tích được mô tả dưới đây áp dụng cho tất cả các tuyên bố trong toàn bộ bản mô tả trừ khi phương pháp xác định phân tích được mô tả cụ thể trong đoạn liên quan.

Phổ khối (Mass spectrometry)

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.

Phương pháp liệt kê 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 một đỉnh tín hiệu, trước tiên, giá trị δ tính bằng ppm và sau đó, cường độ tín hiệu nằm trong dấu ngoặc đơn 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 trong 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 đương với sự trình bày ^1H NMR 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 trong ^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 tương đối 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.

Trị số logP

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).

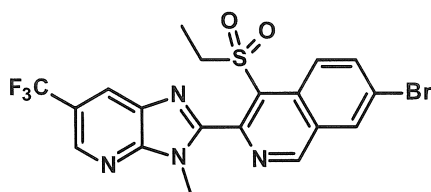
^[b] Trị số logP được xác định bằng phép đo LC-UV trong khoảng trung tính bằng cách sử dụng 79 mg/l amoni cacbonat trong nước và axetonitril làm pha động (gradient tuyến tính từ 10% axetonitril đến 95% axetonitril).

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.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ điều chế:

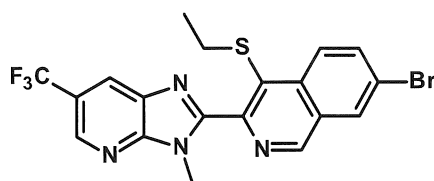
7-7-diclo-2-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-c]pyridin-2-yl]quinolin (I-37)



0,10 g (2,14 mmol) axit formic và 0,34 g (3,00 mmol, nồng độ 30%) hydro peroxit được thêm vào dung dịch chứa 0,20 g (0,43 mmol) 7-bromo-4-etylsulfanyl-3-[3-metyl-6-(trifloetyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin trong 10 ml diclometan. Hỗn hợp thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 6 giờ và sau đó pha loãng bằng dung dịch nước Na₂S₂O₃ và được chiết bằng 30 ml diclometan. Pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô bằng thiết bị bay hơi quay. Cặn được tinh chế bằng HPLC điều chế (pha động: MeCN/H₂O).

Dữ liệu phân tích: Xem danh sách đính

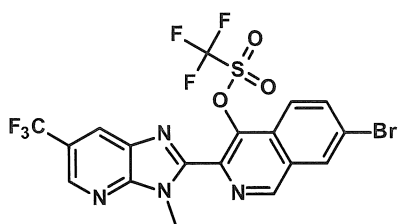
7-Bromo-4-etylsulfanyl-3-[3-metyl-6-(trifloetyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin



10,0 g (162 mmol) EtSH, 2,50 g (2,40 mmol) $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$, 2,80 g (4,90 mmol) xantphos và 6,30 g (48 mmol) bazơ Hünig được thêm vào dung dịch chứa 9,00 g (16,2 mmol) [7-bromo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-4-isoquinolyl] triflometansulfonat trong 50 ml 1,4-dioxan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 80°C trong 16 giờ. Hỗn hợp sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml nước và được chiết bằng etyl axetat (2 x 150 ml). Các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước NaCl bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (pentan/etyl axetat = 8:1).

$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 9,51 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,56 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 3,77 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 0,98 (t, 3H).

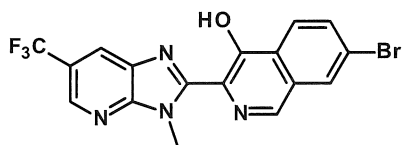
[7-Bromo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-4-isoquinolyl] triflometansulfonat



6,70 g (23,6 mmol) anhydrit triflometansulfonic được thêm vào dung dịch chứa 1,00 g (2,40 mmol) 7-bromo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin-4-ol trong 15 ml pyridin. Hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 16 giờ và sau đó pha loãng bằng dung dịch nước NaHCO_3 . Hỗn hợp được chiết bằng 30 ml etyl axetat và các pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (ete dầu mỏ/etyl axetat = 8:1).

$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 9,67 (s, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,36 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 4,08 (s, 3H).

7-Bromo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin-4-ol

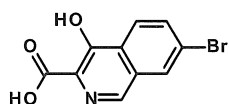


17,2 g (89,7 mmol) EDCI và 2,00 g (14,8 mmol) HOBt được thêm vào hỗn hợp

gồm 15,7 g (82,2 mmol) N²-metyl-5-(triflometyl)pyridin-2,3-diamin, 15,7 g (74,9 mmol) axit 7-bromo-4-hydroxyisoquinolin-3-carboxylic và 20 ml pyridin trong 40 ml CH₃CN. Hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 16 giờ và sau đó được dừng bằng 100 ml nước và được chiết bằng etyl axetat (2 x 400 ml). Các pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Cặn thu được được hòa tan trong 40 ml HOAc và sau đó khuấy ở 80°C trong 16 giờ. Hỗn hợp được dừng bằng cách thêm 100 ml nước và được chiết bằng etyl axetat (2 x 400 ml). Các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước NaCl bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (ete dầu mỗ/etyl axetat = 5:1).

¹H-NMR(400 Mhz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,03 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,10 (br, 1H), 8,03 (d, 1H), 4,48 (s, 3H).

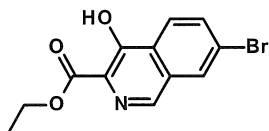
Axit 7-Bromo-4-hydroxyisoquinolin-3-carboxylic



Hỗn hợp gồm 12,0 g (40,7 mmol) etyl 7-bromo-4-hydroxyisoquinolin-3-carboxylat và 3,30 g (81,4 mmol) NaOH trong 30 ml metanol / H₂O (7:1) được khuấy ở 50°C trong 2 giờ. Hỗn hợp phản ứng sau đó được điều chỉnh đến pH 3 bằng cách thêm axit clohydric đặc. Các chất rắn kết tủa được lọc và làm khô.

¹H-NMR(300 Mhz, D₆-DMSO) δ ppm: 8,57 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,02 (d, 1H). Proton -COOH không nhìn thấy trong phổ đo được.

Etyl 7-bromo-4-hydroxyisoquinolin-3-carboxylat

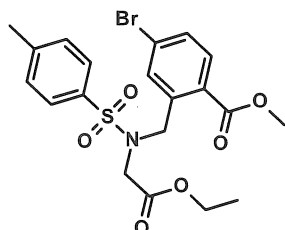


22,0 g (45,5 mmol) metyl 4-bromo-2-[[(2-etoxy-2-oxoetyl)-(p-tolylsulfonyl)amino]metyl]benzoat và 9,80 g (182,2 mmol) NaOEt được hòa tan trong 50 ml etanol và khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 16 giờ. Hỗn hợp phản ứng sau đó được điều chỉnh đến pH 7 bằng cách thêm axit clohydric đặc và chất rắn kết tủa thu được được tách ra bằng cách lọc. Sản phẩm thô được chuyển đổi tiếp mà không cần tinh

chế thêm.

$^1\text{H-NMR}$ (300 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 11,72 (br, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,49 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,03 – 8,00 (m, 1H), 4,46 (q, 2H), 1,39 (t, 3H).

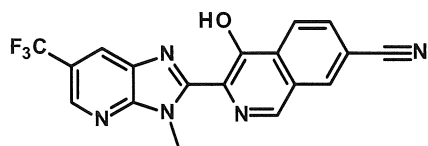
Metyl 4-bromo-2-[[2-etoxy-2-oxoetyl)-(p-tolylsulfonyl)amino]metyl]benzoat



Hỗn hợp gồm 17,0 g (55,6 mmol) metyl 4-bromo-2-(bromometyl)benzoat và 11,5 g (83,3 mmol) kali cacbonat được tạo huyền phù trong 50 ml DMF và khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 20 phút. 15,7 g (61,1 mmol) etyl 2-(p-tolylsulfonylamino)axetat sau đó được thêm vào và hỗn hợp phản ứng thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 16 giờ. Phản ứng được dừng bằng cách thêm 100 ml nước và hỗn hợp sau đó được chiết 2x bằng 150 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ thu gom được rửa bằng 100 ml dung dịch natri clorua bão hòa, làm khô bằng natri sulfate, lọc và cô. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (pha động: pentan/etyl axetat = 8/1).

$^1\text{H-NMR}$ (300 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 7,77 – 7,60 (m, 5), 7,43 (d, 2H), 4,74 (s, 2H), 4,06 (s, 2H), 3,98 (q, 2H), 3,80 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 1,10 (t, 3H).

4-Hydroxy-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin-7-carbonitril

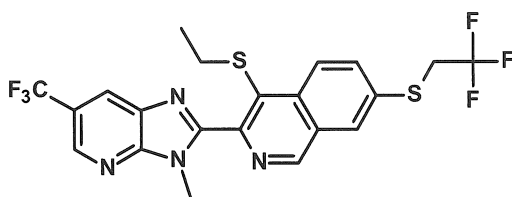


1,60 g (0,789 mmol, nồng độ 10%) $t\text{-Bu}_3\text{P}$ và 59 mg (0,26 mmol) $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ được thêm vào dung dịch chứa 500 mg (1,32 mmol) 7-clo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin-4-ol và 279 mg (0,66 mmol) $\text{K}_4[\text{Fe}(\text{CN})_6] \cdot 3\text{H}_2\text{O}$ trong 10 ml $N\text{-metyl-2-pyrrolidon}$. Hỗn hợp được khuấy dưới môi trường nitơ ở 140°C trong 16 giờ. Phản ứng sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml

nước và hỗn hợp được chiết 2x bằng 150 ml etyl axetat. Các pha hữu cơ thu gom được rửa bằng dung dịch natri clorua bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Sản phẩm thô được tinh chế bằng HPLC điều chế (MeCN/H₂O).

¹H-NMR(300 Mhz, D₆-DMSO) δ ppm: 14,58 (br, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,86 – 8,83 (m, 2H), 8,70 (s, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 4,46 (s, 3H).

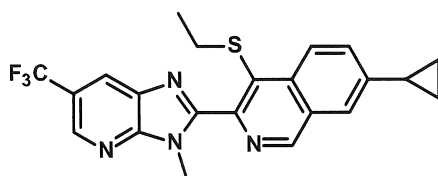
4-Etylsulfanyl-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-7-(2,2,2-trifloetylsulfanyl)isoquinolin



Kết hợp với khuấy, 149 mg (1,28 mmol) 2,2,2-triflometan-1-thiol, 144 mg (1,28 mmol) t-BuOK, 122 mg (0,64 mmol) CuI và 182 mg (1,28 mmol) N1,N2-dimetylxyclohexan-1,2-diamin được thêm vào dung dịch chứa 300 mg (0,64 mmol) 7-bromo-4-etylsulfanyl-3-[3-metyl-6-(trifloetyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin trong 10 ml DMF. Hỗn hợp phản ứng được đun nóng trong lò vi sóng ở 140°C trong 2 giờ và sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml nước. Hỗn hợp được chiết 2x bằng 150 ml etyl axetat, và các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri clorua bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (pentan/etyl axetat = 8/1).

¹H-NMR(300 Mhz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,44 (s, 1H), 8,87 (d, 1H), 8,65 (d, 1H), 8,57 (d, 1H), 8,49 (d, 1H), 8,13 (dd, 1H), 4,35 (q, 2H), 3,77 (s, 3H), 2,84 (q, 2H), 0,98 (t, 3H).

7-Xyclopropyl-4-etylsulfanyl-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin

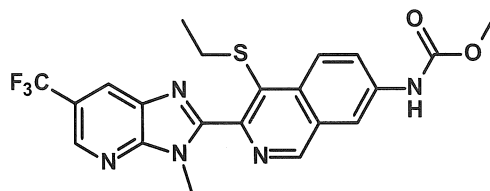


Kết hợp với khuấy, 276 mg (3,21 mmol) axit xyclopropylboronic, 74 mg (0,06

mmol) $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ và 314 mg (0,96 mmol) Cs_2CO_3 được thêm vào dung dịch chứa 300 mg (0,64 mmol) 7-bromo-4-ethylsulfanyl-3-[3-methyl-6-(trifloetyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin trong 10 ml THF. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 85°C trong 16 giờ và sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml nước. Hỗn hợp được chiết 2x bằng 150 ml etyl axetat, và các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri clorua bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Cặn được tinh chế bằng sắc ký lớp mỏng điều chế trên silicagel (pentan/etyl axetat = 8/1).

LC-MS: R_t (phút): 1,37; MS: $(\text{M}+\text{H}^+)$: 429,

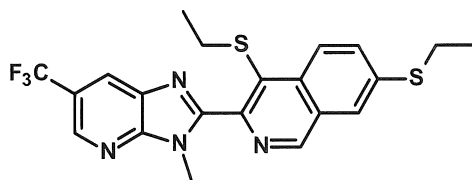
Metyl N-[4-ethylsulfanyl-3-[3-methyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-7-isoquinolyl]carbamate



Kết hợp với khuấy, 96 mg (1,28 mmol) metyl carbamat, 67 mg (0,06 mmol) $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$, 74 mg (0,13 mmol) xantphos và 419 mg (1,28 mmol) Cs_2CO_3 được thêm vào dung dịch chứa 200 mg (0,43 mmol) 7-bromo-4-ethylsulfanyl-3-[3-methyl-6-(trifloetyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin trong 10 ml 1,4-dioxan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 110°C trong 16 giờ và sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml nước. Hỗn hợp được chiết 2x bằng 150 ml etyl axetat, và các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước natri clorua bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô. Cặn được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (pha động: pentan/etyl axetat = 8/1).

$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 10,36 (br, 1H), 9,40 (s, 1H), 8,86 (d, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,02 (dd, 1H), 3,77 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 2,81 (q, 2H), 0,97 (t, 3H).

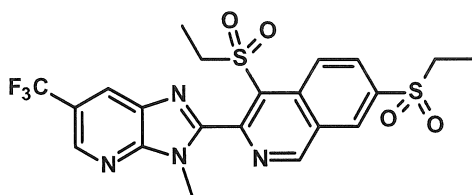
4,7-Bis(ethylsulfanyl)-3-[3-methyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin



670 mg (10,8 mmol) EtSH, 170 mg (0,16 mmol) $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$, 190 mg (0,32 mmol) xantphos và 420 mg (3,25 mmol) bazơ Hünig được thêm vào dung dịch chứa 600 mg (1,10 mmol) [7-bromo-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]-4-isoquinolyl] triflometansulfonat trong 15 ml 1,4-dioxan. Hỗn hợp phản ứng được khuấy ở 80°C trong 16 giờ. Hỗn hợp sau đó được dừng bằng cách thêm 100 ml nước và được chiết bằng etyl axetat (2 x 150 ml). Các pha hữu cơ được rửa bằng dung dịch nước NaCl bão hòa, làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô dưới áp suất giảm. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột trên silicagel (pentan/etyl axetat = 8:1).

$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 9,43 (s, 1H), 8,87 (d, 1H), 8,66 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,94 (dd, 1H), 3,77 (s, 3H), 3,24 (q, 2H), 2,83 (q, 2H), 1,38 (t, 3H), 0,98 (t, 3H).

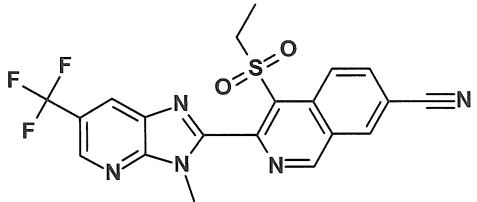
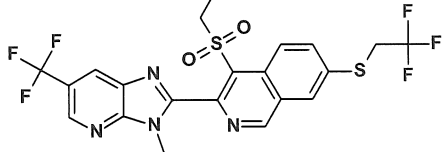
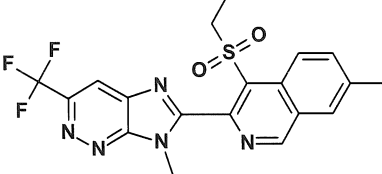
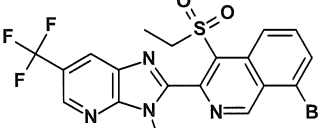
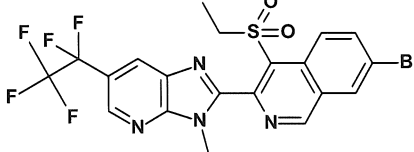
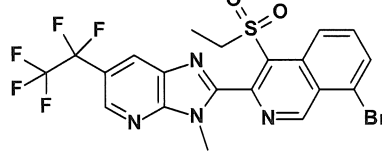
4,7-Bis(etylsulfonyl)-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin (I-34)



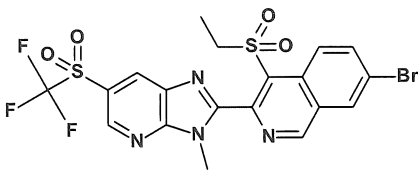
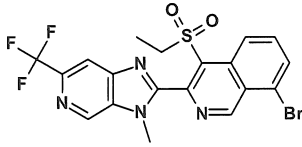
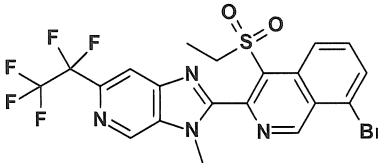
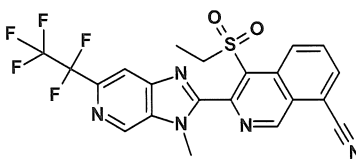
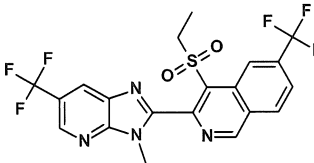
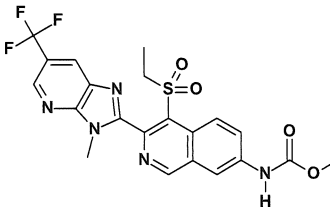
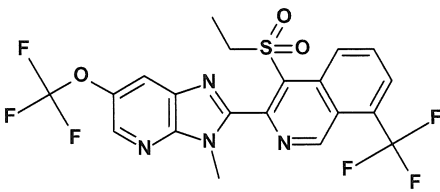
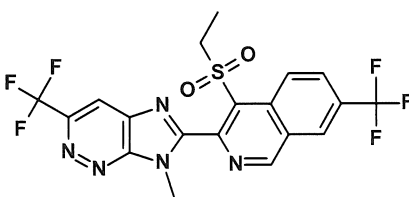
0,10 g (2,23 mmol) axit formic và 0,35 g (3,11 mmol, nồng độ 30%) hydro peroxit được thêm vào dung dịch chứa 0,20 g (0,44 mmol) 4,7-bis(etylsulfanyl)-3-[3-metyl-6-(triflometyl)imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl]isoquinolin trong 10 ml diclometan. Hỗn hợp thu được được khuấy ở nhiệt độ trong phòng trong 6 giờ và sau đó pha loãng bằng dung dịch nước $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ và được chiết bằng 30 ml diclometan. Pha hữu cơ được làm khô bằng natri sulfat, lọc và cô bằng thiết bị bay hơi quay. Cặn được tinh chế bằng HPLC điều chế (pha động: MeCN / H_2O).

Dữ liệu phân tích: Xem danh sách đỉnh

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 số	Cấu trúc phân tử
I-001	
I-002	
I-003	
I-004	
I-005	
I-006	

I-007	
I-008	
I-010	
I-012	
I-013	
I-014	
I-015	

I-016	
I-018	
I-019	
I-020	
I-021	
I-022	
I-024	
I-025	

I-026	
I-027	
I-028	
I-029	
I-030	
I-031	
I-032	
I-033	

I-034	
I-035	
I-036	
I-037	
I-038	
I-039	
I-041	

I-042	
I-043	
I-044	
I-045	
I-046	
I-048	
I-049	
I-050	

I-051	
I-052	
I-053	

Các chi tiết thêm về danh sách các đỉnh ^1H NMR có thể được thấy trong cơ sở dữ liệu nghiên cứu Research Disclosure Database Number 564025.

Dữ liệu NMR của các hợp chất ví dụ
Ví dụ I-001: ^1H-NMR(300,1 Mhz, d_6-DMSO): δ= 9,8846 (5,2); 9,1571 (4,8); 9,0899 (2,7); 9,0597 (2,8); 8,8944 (4,4); 8,6420 (4,5); 8,4626 (2,6); 8,4339 (2,3); 7,8737 (0,4); 3,8722 (4,3); 3,8479 (4,7); 3,8070 (16,0); 3,3248 (6,6); 2,5046 (21,7); 1,3141 (5,0); 1,2899 (8,9); 1,2659 (4,7); 0,0002 (5,0); -0,0325 (0,3)
Ví dụ I-002: ^1H-NMR(400,2 Mhz, d_6-DMSO): δ= 13,5911 (1,0); 13,4609 (0,9); 13,2905 (1,0); 12,4422 (1,0); 12,0071 (1,0); 10,6649 (0,9); 9,6916 (9,8); 8,8855 (9,3); 8,8650 (5,3); 8,6510 (1,0); 8,6271 (7,9); 8,6147 (7,7); 8,5602 (1,0); 8,2386 (4,0); 8,2115 (3,7); 6,1154 (1,1); 5,3165 (1,0); 5,0188 (1,0); 4,9069 (0,9); 4,8574 (0,9); 4,7135 (1,0); 4,6924 (1,1); 4,6428 (1,1); 4,5154 (1,1); 4,4914 (0,9); 4,4694 (1,0); 4,4139 (2,9); 4,3916 (6,6); 4,3710 (8,4); 4,3428 (2,8); 4,2927 (1,2); 4,2783 (1,2); 4,2667 (1,2); 4,2613 (1,1); 4,2225 (1,2); 4,2149 (1,1); 4,2018 (1,2); 4,1791 (1,1); 4,1551 (1,0); 4,1384 (1,2); 4,1094 (1,3); 4,0980 (1,2); 4,0777 (1,0); 4,0632 (1,0); 4,0435 (1,2); 4,0013 (1,2); 3,9760 (1,5); 3,9635 (1,5); 3,9558 (1,5); 3,9014 (1,6); 3,8232 (6,2); 3,8055 (7,0); 3,7827 (31,8); 3,7310 (2,0); 3,7151 (2,2); 3,6952 (2,0); 3,6803 (2,2); 3,6545 (2,4); 3,6299 (2,4); 3,5877 (2,9); 3,5619 (3,1); 3,5394 (3,5); 3,5205 (4,4); 3,5080 (4,9); 3,4556 (12,9); 3,4394 (16,9); 3,3469 (6593,6); 3,1720 (2,7); 3,1177 (1,8); 3,1094 (1,4); 3,0696 (1,6); 3,0486 (1,2); 3,0358 (1,4); 3,0243 (1,4); 3,0133 (1,2); 2,9900 (1,3); 2,9677 (0,9); 2,9568 (1,0); 2,9152 (1,0); 2,8983 (1,0); 2,8467 (1,0); 2,7963 (1,3); 2,7745 (1,4); 2,7571 (1,5); 2,6754 (13,0); 2,5059 (1958,8); 2,3319 (12,7); 2,2262 (1,0); 2,2160 (1,0); 2,1607 (1,0); 2,0902 (1,1); 2,0633 (0,9); 1,7061 (0,9); 1,3489 (1,0); 1,2902 (8,3); 1,2713 (16,0); 1,2528 (8,6); 1,0748 (6,7); 1,0574 (12,3); 1,0396 (6,2); 0,1491 (2,3); 0,0959 (0,9); 0,0029 (456,2); -0,0762 (1,4); -0,1463 (3,1); -

2,9354 (1,0); -3,0078 (1,0); -3,1700 (0,9); -3,3703 (1,0); -3,5239 (1,0); -3,5828 (1,0)
Ví dụ I-003: ¹ H-NMR(300,1 Mhz, d ₆ -DMSO): δ = 9,7353 (4,6); 8,8417 (2,0); 8,8121 (2,2); 8,7133 (6,2); 8,3006 (2,7); 8,0680 (1,5); 8,0629 (1,5); 8,0382 (1,4); 8,0331 (1,4); 3,9394 (16,0); 3,7696 (0,8); 3,7451 (2,3); 3,7205 (2,4); 3,6967 (0,8); 3,3250 (4,9); 2,6484 (10,5); 2,5076 (17,0); 2,5020 (21,9); 2,4967 (15,9); 1,2682 (3,9); 1,2435 (8,3); 1,2188 (3,7); -0,0007 (12,4)
Ví dụ I-004: ¹ H-NMR(400,2 Mhz, CDCl ₃): δ = 9,9674 (4,2); 9,1339 (2,0); 9,1120 (2,1); 8,7648 (2,8); 8,2878 (2,8); 8,2858 (2,8); 8,1351 (2,1); 8,1162 (2,4); 7,8612 (1,5); 7,8414 (2,0); 7,8397 (2,0); 7,8204 (1,3); 7,2622 (13,0); 3,9194 (16,0); 3,8495 (1,0); 3,8308 (3,2); 3,8121 (3,2); 3,7933 (1,1); 1,5658 (15,8); 1,4786 (3,9); 1,4600 (8,0); 1,4413 (3,8); 0,0003 (12,7)
Ví dụ I-005: ¹ H-NMR(400,2 Mhz, CDCl ₃): δ = 9,4401 (2,9); 9,4389 (3,0); 9,0387 (1,5); 9,0153 (1,6); 8,7069 (1,6); 8,7024 (1,6); 8,3710 (2,0); 8,3658 (2,1); 8,2569 (1,6); 8,2522 (1,7); 8,0945 (1,5); 8,0893 (1,5); 8,0713 (1,4); 8,0660 (1,4); 7,2612 (34,5); 5,3008 (1,1); 3,9460 (0,4); 3,9033 (16,0); 3,8347 (0,6); 3,8160 (1,8); 3,7973 (1,8); 3,7786 (0,6); 1,5520 (22,1); 1,4683 (3,4); 1,4496 (7,3); 1,4309 (3,2); 1,2543 (0,9); 0,0080 (1,1); -0,0002 (35,8); -0,0085 (1,1)
Ví dụ I-006: ¹ H-NMR(400,2 Mhz, CDCl ₃): δ = 9,9661 (3,4); 9,9643 (3,4); 9,1372 (1,6); 9,1151 (1,7); 8,7102 (1,9); 8,7060 (1,9); 8,2632 (2,0); 8,2588 (2,0); 8,1373 (1,7); 8,1356 (1,7); 8,1184 (2,0); 8,1167 (1,9); 7,8637 (1,6); 7,8447 (1,6); 7,8417 (1,7); 7,8227 (1,4); 7,2626 (11,4); 5,3005 (1,1); 4,0447 (0,5); 3,9215 (16,0); 3,8530 (0,8); 3,8343 (2,4); 3,8156 (2,5); 3,7970 (0,8); 2,9857 (0,5); 1,5922 (5,0); 1,4812 (3,7); 1,4625 (7,7); 1,4438 (3,5); 0,0080 (0,4); -0,0002 (11,0); -0,0085 (0,4)
Ví dụ I-007: ¹ H-NMR(400,2 Mhz, d ₆ -DMSO): δ = 9,6618 (3,8); 8,8738 (2,1); 8,8706 (2,1); 8,8322 (1,7); 8,8096 (2,0); 8,6165 (2,2); 8,6127 (2,2); 8,1871 (2,2); 8,1831 (2,1); 7,9119 (1,4); 7,9071 (1,4); 7,8892 (1,3); 7,8845 (1,2); 7,6487 (0,4); 7,6250 (0,6); 7,6190 (0,4); 7,6152 (0,5); 7,5984 (0,6); 7,5773 (0,5); 7,5688 (0,5); 7,5509 (0,4); 4,3533 (1,0); 3,7811 (1,3); 3,7633 (16,0); 3,3440 (234,9); 2,6777 (0,6); 2,6726 (0,7); 2,5126 (48,3); 2,5082 (101,8); 2,5037 (138,3); 2,4992 (98,9); 2,4949 (45,4); 2,3306 (0,8); 2,2978 (0,5); 2,2894 (0,6); 2,2773 (1,0); 2,2664 (0,6); 2,2576 (0,5); 1,2713 (3,4); 1,2528 (7,6); 1,2342 (3,5); 1,2147 (0,6); 1,2032 (1,7); 1,1977 (1,8); 1,1823 (1,7); 1,1768 (1,8); 1,1670 (0,7); 0,9825 (0,8); 0,9720 (2,0); 0,9669 (1,9); 0,9597 (1,8); 0,9543 (2,2); 0,9429 (0,6); 0,1471 (0,4); 0,0089 (3,5); 0,0007 (104,3); -0,0076 (3,5); -0,1483 (0,4)
Ví dụ I-008: ¹ H-NMR(300,1 Mhz, d ₆ -DMSO): δ = 9,8116 (5,2); 8,9631 (2,5); 8,9319 (2,7); 8,7322 (6,0); 8,7034 (3,5); 8,6972 (3,5); 8,2466 (1,9); 8,2399 (1,9); 8,2156 (1,8); 8,2088 (1,7); 4,0407 (0,5); 4,0172 (0,6); 3,9927 (0,4); 3,9523 (16,0); 3,8071 (1,0); 3,7831 (2,8); 3,7582 (2,9); 3,7346

(1,1); 3,3315 (5,9); 2,5034 (17,0); 1,9900 (2,0); 1,2831 (4,2); 1,2586 (8,6); 1,2339 (4,5); 1,1984 (0,7); 1,1747 (1,1); 1,1509 (0,6); 1,1424 (0,5); -0,0009 (6,7)
Ví dụ I-010: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,7735 (4,6); 8,9777 (2,2); 8,9544 (2,4); 8,8829 (2,6); 8,8800 (2,5); 8,6671 (2,8); 8,6616 (2,8); 8,6256 (2,7); 8,6219 (2,6); 8,2127 (1,7); 8,2070 (1,6); 8,1894 (1,6); 8,1836 (1,5); 3,8497 (0,6); 3,8317 (1,9); 3,8131 (2,0); 3,7834 (16,0); 3,3218 (18,5); 2,5062 (25,4); 2,5019 (32,8); 2,4977 (23,5); 2,0754 (0,5); 1,2914 (3,8); 1,2729 (8,1); 1,2544 (3,6); -0,0003 (14,9); -0,0084 (0,6)
Ví dụ I-012: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,8591 (1,9); 9,3155 (4,0); 9,3015 (1,6); 9,2793 (1,7); 9,1728 (0,5); 8,5022 (1,6); 8,4840 (1,9); 8,3241 (1,1); 8,3159 (0,3); 8,3024 (1,5); 8,2948 (4,4); 8,2837 (1,0); 5,7563 (3,4); 4,5100 (0,4); 3,9214 (16,0); 3,8731 (0,5); 3,8548 (1,4); 3,8366 (1,4); 3,8181 (0,5); 3,5798 (0,4); 3,5614 (0,3); 3,3229 (59,4); 2,6758 (0,6); 2,6714 (0,8); 2,6669 (0,6); 2,5249 (2,5); 2,5200 (3,8); 2,5113 (50,0); 2,5070 (101,5); 2,5025 (133,2); 2,4980 (95,7); 2,4935 (46,4); 2,3338 (0,6); 2,3294 (0,8); 2,3247 (0,6); 2,0865 (1,3); 1,3975 (0,4); 1,3070 (4,0); 1,2885 (8,7); 1,2700 (3,9); 1,2347 (0,6); 1,1918 (0,4); 1,1734 (0,8); 1,1551 (0,4); 0,0079 (0,9); -0,0001 (27,0); -0,0084 (0,9)
Ví dụ I-013: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,8570 (2,0); 9,3025 (1,7); 9,2926 (4,0); 9,2804 (1,8); 8,4998 (1,6); 8,4812 (1,9); 8,3218 (1,1); 8,3152 (0,4); 8,3009 (1,4); 8,2812 (0,9); 8,2691 (4,1); 5,7550 (2,0); 3,9225 (16,0); 3,8753 (0,5); 3,8568 (1,4); 3,8384 (1,4); 3,8204 (0,6); 3,3254 (74,9); 2,6763 (0,4); 2,6719 (0,6); 2,6674 (0,4); 2,5251 (1,5); 2,5202 (2,4); 2,5117 (32,5); 2,5073 (66,3); 2,5028 (87,4); 2,4983 (63,7); 2,4939 (31,5); 2,3342 (0,4); 2,3296 (0,6); 2,3254 (0,4); 1,3079 (4,0); 1,2894 (8,7); 1,2708 (3,9); 0,0078 (2,0); -0,0002 (61,1); -0,0083 (2,4)
Ví dụ I-014: ¹H-NMR(600,4 Mhz, CDCl₃): δ= 9,8837 (1,5); 9,4070 (1,3); 9,3922 (1,3); 8,7197 (1,8); 8,7166 (1,8); 8,2663 (1,9); 8,2632 (1,9); 8,2356 (1,2); 8,2235 (1,4); 8,0815 (0,8); 8,0675 (1,0); 8,0545 (0,7); 7,2604 (11,5); 5,2980 (1,6); 3,9462 (16,0); 3,8876 (0,8); 3,8752 (2,4); 3,8627 (2,4); 3,8503 (0,8); 3,1177 (0,4); 1,5748 (3,0); 1,4952 (3,5); 1,4828 (7,5); 1,4703 (3,5); 1,2557 (0,4); -0,0001 (8,9)
Ví dụ I-015: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,6955 (4,1); 9,0689 (0,4); 8,8678 (2,5); 8,8580 (2,0); 8,8357 (1,9); 8,6413 (0,3); 8,6090 (2,5); 8,4548 (0,4); 8,2674 (2,4); 8,2335 (0,5); 8,1569 (0,3); 8,0326 (1,5); 8,0109 (1,4); 7,9474 (0,4); 6,5358 (1,2); 4,3727 (1,3); 3,7867 (1,9); 3,7701 (16,0); 3,4874 (0,4); 3,4692 (0,5); 3,3212 (158,2); 3,2013 (0,7); 3,0786 (0,3); 3,0193 (0,3); 2,6937 (1,3); 2,6699 (4,7); 2,6656 (3,7); 2,6364 (10,0); 2,5053 (535,8); 2,5009 (723,2); 2,4966 (543,7); 2,3321 (7,2); 2,3278 (8,2); 1,2758 (3,5); 1,2574 (7,6); 1,2387 (4,2); 1,1858 (0,4); 1,1668 (0,7); 1,1486 (0,6); 0,1458 (1,7); 0,0077 (16,7); -0,0003 (375,2); -0,0083 (22,4); -0,1012 (1,5); -0,1498 (2,4)
Ví dụ I-016: ¹H-NMR(600,1 Mhz, d₆-DMSO):

$\delta = 3,8272$ (0,6); $3,3173$ (16,0); $2,5075$ (4,7); $2,5045$ (10,4); $2,5014$ (14,6); $2,4984$ (10,4); $2,4953$ (4,7); $1,3982$ (0,5); $0,0053$ (0,4); $-0,0001$ (13,0); $-0,0057$ (0,4)

Ví dụ I-018:

$^1\text{H-NMR}$ (400,2 Mhz, CDCl_3):

$\delta = 9,9674$ (3,7); $9,1297$ (1,8); $9,1076$ (1,9); $8,9995$ (3,3); $8,1473$ (1,9); $8,1285$ (2,1); $8,0946$ (3,5); $7,8734$ (1,5); $7,8543$ (1,5); $7,8516$ (1,7); $7,8324$ (1,3); $7,2625$ (16,1); $5,3009$ (1,4); $3,9344$ (16,0); $3,8145$ (0,8); $3,7958$ (2,3); $3,7772$ (2,3); $3,7585$ (0,8); $1,5849$ (7,4); $1,4686$ (3,7); $1,4500$ (7,8); $1,4312$ (3,6); $1,2548$ (0,3); $0,0073$ (0,8); $-0,0002$ (19,8); $-0,0084$ (0,8)

Ví dụ I-019:

$^1\text{H-NMR}$ (400,2 Mhz, CDCl_3):

$\delta = 9,9672$ (3,2); $9,9651$ (3,4); $9,1334$ (1,6); $9,1134$ (1,0); $9,1114$ (1,7); $9,1095$ (1,1); $9,0212$ (2,9); $8,1494$ (1,6); $8,1475$ (1,7); $8,1305$ (1,9); $8,1286$ (1,9); $8,1186$ (3,1); $8,1163$ (3,2); $7,8747$ (1,6); $7,8558$ (1,5); $7,8527$ (1,7); $7,8338$ (1,4); $7,2616$ (20,1); $5,3006$ (12,6); $3,9339$ (16,0); $3,8211$ (0,6); $3,8024$ (1,7); $3,7838$ (1,8); $3,7651$ (0,6); $1,5624$ (20,1); $1,4726$ (3,6); $1,4539$ (7,8); $1,4352$ (3,5); $0,0080$ (0,6); $-0,0002$ (19,8); $-0,0084$ (0,6)

Ví dụ I-020:

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

$\delta = 9,8948$ (4,0); $9,8928$ (4,3); $9,3156$ (3,8); $9,2772$ (1,8); $9,2548$ (2,0); $8,6671$ (2,0); $8,6489$ (2,2); $8,3220$ (1,7); $8,3160$ (0,3); $8,3037$ (1,8); $8,2990$ (5,1); $8,2814$ (1,6); $3,9033$ (16,0); $3,8724$ (0,5); $3,8539$ (1,2); $3,8357$ (1,2); $3,8172$ (0,5); $3,3225$ (39,3); $2,6756$ (0,6); $2,6710$ (0,8); $2,6664$ (0,6); $2,5245$ (2,5); $2,5198$ (3,8); $2,5110$ (47,9); $2,5066$ (99,5); $2,5020$ (132,1); $2,4975$ (94,6); $2,4929$ (45,2); $2,3335$ (0,6); $2,3288$ (0,8); $2,3243$ (0,6); $2,0747$ (4,3); $1,2969$ (3,9); $1,2784$ (8,6); $1,2598$ (3,8); $-0,0002$ (2,3)

Ví dụ I-021:

$^1\text{H-NMR}$ (400,1 Mhz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):

$\delta = 9,9888$ (4,6); $9,3370$ (2,8); $8,8960$ (2,7); $8,8928$ (2,7); $8,7750$ (1,8); $8,7536$ (1,9); $8,6456$ (2,8); $8,6421$ (2,7); $8,3497$ (1,7); $8,3282$ (1,5); $8,3255$ (1,5); $3,9439$ (0,8); $3,9254$ (2,3); $3,9069$ (2,3); $3,8884$ (0,8); $3,7988$ (16,0); $3,3148$ (16,4); $2,5075$ (10,6); $2,5032$ (13,8); $2,4988$ (10,1); $1,3076$ (3,8); $1,2891$ (8,1); $1,2706$ (3,7); $-0,0002$ (7,8)

Ví dụ I-022:

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

$\delta = 10,4806$ (2,5); $9,6903$ (3,7); $9,5278$ (0,4); $8,8783$ (2,2); $8,8665$ (2,4); $8,8630$ (2,4); $8,8550$ (2,1); $8,6373$ (0,3); $8,6038$ (4,2); $8,0888$ (1,3); $8,0831$ (1,2); $8,0652$ (1,2); $8,0595$ (1,2); $3,8016$ (0,8); $3,7807$ (14,8); $3,7670$ (16,0); $3,7468$ (2,1); $3,5078$ (0,8); $3,3280$ (22,0); $2,5066$ (40,1); $2,5022$ (54,0); $2,4978$ (39,8); $2,3288$ (0,4); $2,0762$ (1,5); $1,2774$ (3,6); $1,2588$ (7,8); $1,2400$ (5,4); $1,2345$ (4,0); $1,1856$ (0,3); $0,8533$ (0,6); $0,8366$ (0,4); $0,0078$ (1,0); $-0,0002$ (22,7); $-0,0083$ (1,0)

Ví dụ I-024:

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

$\delta = 9,8524$ (1,6); $9,3012$ (1,4); $9,2787$ (1,4); $8,6170$ (1,8); $8,6124$ (1,8); $8,6110$ (1,7); $8,4929$ (1,3); $8,4743$ (1,6); $8,3711$ (1,7); $8,3677$ (1,6); $8,3652$ (1,4); $8,3148$ (0,9); $8,2934$ (1,1); $8,2744$ (0,8); $5,7577$ (2,4); $3,9012$ (0,6); $3,8829$ (1,8); $3,8643$ (1,8); $3,8461$ (0,6); $3,7883$ (16,0); $3,3242$ (215,3); $2,6799$ (0,6); $2,6752$ (1,3); $2,6706$ (1,8); $2,6662$ (1,2); $2,6617$ (0,6); $2,5242$ (5,0); $2,5195$ (7,2); $2,5108$

(102,8); 2,5063 (213,9); 2,5017 (282,2); 2,4971 (197,1); 2,4926 (91,4); 2,3377 (0,6); 2,3331 (1,2); 2,3285 (1,7); 2,3240 (1,2); 2,3194 (0,6); 1,3185 (3,6); 1,3000 (8,2); 1,2815 (3,5); -0,0002 (2,6)
Ví dụ I-025: ¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO): δ= 10,0264 (4,4); 9,1539 (1,6); 9,1233 (1,8); 9,0825 (2,4); 8,7428 (7,0); 8,4810 (1,4); 8,4748 (1,4); 8,4504 (1,3); 8,4440 (1,3); 3,9687 (16,0); 3,8376 (0,8); 3,8127 (2,3); 3,7878 (2,4); 3,7632 (0,8); 3,3213 (14,8); 3,2974 (0,4); 2,5084 (14,2); 2,5026 (18,9); 2,4970 (13,6); 1,3005 (3,8); 1,2758 (8,3); 1,2511 (3,7); -0,0005 (7,1)
Ví dụ I-026: ¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃): δ= 9,9676 (2,9); 9,9654 (3,0); 9,4478 (0,9); 9,4454 (1,6); 9,4432 (0,9); 9,4254 (0,9); 9,4230 (1,6); 9,4208 (0,9); 8,7857 (1,6); 8,7824 (1,6); 8,2993 (1,6); 8,2956 (1,7); 8,2858 (1,3); 8,2836 (1,4); 8,2677 (1,6); 8,2654 (1,6); 8,1098 (1,5); 8,0916 (1,3); 8,0874 (1,5); 8,0693 (1,2); 7,2612 (30,0); 3,9388 (16,0); 3,9169 (0,8); 3,8982 (2,6); 3,8795 (2,6); 3,8609 (0,8); 1,5514 (16,2); 1,4983 (3,3); 1,4796 (7,2); 1,4609 (3,2); 0,0694 (1,0); 0,0080 (1,0); -0,0002 (31,0); -0,0085 (0,9)
Ví dụ I-027: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,9665 (3,8); 9,9646 (4,0); 8,9890 (1,8); 8,9670 (1,9); 8,7325 (5,7); 8,4124 (2,0); 8,3935 (2,2); 8,1060 (1,6); 8,0868 (1,7); 8,0842 (1,8); 8,0650 (1,5); 3,9617 (16,0); 3,8019 (0,6); 3,7833 (1,7); 3,7647 (1,6); 3,7467 (0,6); 3,3333 (35,2); 2,6802 (0,4); 2,6758 (0,8); 2,6712 (1,0); 2,6667 (0,8); 2,6621 (0,4); 2,5246 (3,2); 2,5199 (4,9); 2,5112 (61,0); 2,5068 (125,1); 2,5022 (165,0); 2,4977 (118,1); 2,4932 (56,8); 2,3381 (0,3); 2,3336 (0,7); 2,3290 (1,0); 2,3244 (0,7); 2,0746 (0,5); 1,2799 (3,8); 1,2614 (8,6); 1,2429 (3,8); -0,0002 (3,0)
Ví dụ I-028: ¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO): δ= 9,8021 (4,3); 8,8743 (2,0); 8,8526 (3,8); 8,8493 (4,4); 8,7232 (6,1); 8,3451 (1,7); 8,3395 (1,5); 8,3221 (1,4); 8,3164 (1,8); 5,7558 (1,4); 3,9495 (16,0); 3,7899 (0,6); 3,7720 (1,7); 3,7538 (1,7); 3,7353 (0,6); 3,5857 (0,4); 3,5799 (0,6); 3,3233 (91,2); 2,6757 (0,7); 2,6712 (0,9); 2,6667 (0,7); 2,6620 (0,4); 2,5246 (2,7); 2,5111 (53,5); 2,5067 (108,3); 2,5022 (142,3); 2,4977 (102,8); 2,4933 (50,2); 2,3335 (0,6); 2,3291 (0,9); 2,3244 (0,7); 1,2743 (3,8); 1,2558 (8,5); 1,2373 (4,0); 0,1459 (0,7); 0,0080 (5,7); -0,0001 (158,7); -0,0084 (6,4); -0,1496 (0,7)
Ví dụ I-029: ¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃): δ= 9,9786 (3,1); 9,9765 (3,2); 9,1290 (1,6); 9,1270 (1,0); 9,1090 (1,0); 9,1070 (1,6); 9,1050 (1,0); 9,0764 (2,1); 9,0713 (2,1); 8,6550 (1,9); 8,6500 (1,9); 8,1628 (1,5); 8,1609 (1,6); 8,1439 (1,8); 8,1420 (1,7); 7,8878 (1,5); 7,8688 (1,4); 7,8658 (1,6); 7,8468 (1,3); 7,2620 (20,1); 5,3010 (1,3); 3,9494 (16,0); 3,8167 (0,7); 3,7981 (2,1); 3,7794 (2,2); 3,7608 (0,7); 1,5652 (16,4); 1,4882 (3,4); 1,4695 (7,4); 1,4508 (3,3); 0,0079 (0,6); -0,0002 (20,9); -0,0085 (0,6)
Ví dụ I-030: ¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃): δ= 9,9670 (3,1); 9,9648 (3,1); 9,4520 (0,9); 9,4498 (1,6); 9,4475 (0,9); 9,4297 (1,0); 9,4274 (1,7); 9,4251 (0,9); 8,7292 (1,6); 8,7246 (1,6); 8,2876 (1,4); 8,2853

(1,4); 8,2736 (1,9); 8,2694 (3,4); 8,1126 (1,5); 8,0945 (1,3); 8,0902 (1,5); 8,0721 (1,3); 7,2615 (17,0); 5,3008 (11,9); 3,9419 (16,0); 3,9222 (0,8); 3,9034 (2,4); 3,8847 (2,5); 3,8661 (0,8); 2,0089 (0,8); 1,5582 (7,8); 1,5012 (3,4); 1,4825 (7,3); 1,4638 (3,2); 0,0698 (1,0); 0,0079 (0,7); -0,0002 (18,1); -0,0086 (0,5)

Ví dụ I-031:

¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃):

δ= 10,0075 (3,3); 10,0054 (3,2); 9,0904 (0,8); 9,0882 (0,8); 9,0782 (1,3); 9,0761 (1,1); 9,0660 (0,9); 9,0638 (0,8); 8,7101 (1,7); 8,7056 (1,7); 8,2621 (1,8); 8,2575 (1,8); 7,9303 (3,1); 7,9277 (2,9); 7,9177 (3,3); 7,9159 (3,0); 7,2610 (34,5); 5,3007 (1,8); 3,9205 (16,0); 3,8524 (0,7); 3,8337 (2,2); 3,8150 (2,2); 3,7963 (0,7); 1,5485 (16,7); 1,4820 (3,5); 1,4633 (7,5); 1,4446 (3,4); 1,2552 (0,3); 0,0080 (1,0); -0,0002 (36,2); -0,0084 (1,1)

Ví dụ I-032:

¹H-NMR(400,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,8633 (2,2); 9,3049 (1,7); 9,2827 (1,8); 8,8956 (2,5); 8,8923 (2,6); 8,6468 (2,6); 8,6429 (2,6); 8,4989 (1,7); 8,4805 (2,0); 8,3215 (1,1); 8,3006 (1,5); 8,2809 (0,9); 3,9033 (0,8); 3,8849 (2,2); 3,8664 (2,2); 3,8480 (0,9); 3,8216 (16,0); 3,3357 (9,6); 2,5085 (12,7); 2,5041 (17,3); 2,4998 (12,9); 1,3225 (3,9); 1,3040 (8,2); 1,2854 (3,7); 0,0079 (0,4); 0,0000 (7,9); -0,0080 (0,3)

Ví dụ I-033:

¹H-NMR(400,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,6674 (4,0); 8,8843 (1,9); 8,8660 (2,4); 8,8612 (3,9); 8,6007 (2,3); 8,5969 (2,2); 7,9224 (2,1); 7,9156 (2,4); 7,8169 (1,6); 7,8100 (1,4); 7,7931 (1,5); 7,7862 (1,4); 4,0272 (14,3); 3,8067 (0,6); 3,7884 (1,5); 3,7658 (16,0); 3,3189 (368,8); 3,2954 (3,8); 2,6746 (0,9); 2,6702 (1,2); 2,6656 (0,9); 2,6610 (0,4); 2,5100 (73,5); 2,5056 (148,6); 2,5011 (198,1); 2,4967 (140,8); 2,4924 (66,5); 2,3325 (0,9); 2,3279 (1,2); 2,3234 (0,9); 1,2739 (3,5); 1,2554 (7,7); 1,2368 (3,5); 0,0080 (1,2); -0,0001 (30,9); -0,0084 (1,2)

Ví dụ I-034:

¹H-NMR(400,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 10,0649 (4,4); 9,1697 (2,1); 9,1468 (2,4); 9,1358 (2,8); 9,1313 (2,7); 8,8957 (2,3); 8,8922 (2,4); 8,6438 (2,5); 8,6400 (2,4); 8,5321 (1,8); 8,5271 (1,6); 8,5092 (1,7); 8,5041 (1,6); 6,5184 (0,6); 3,8945 (0,8); 3,8768 (2,1); 3,8585 (2,1); 3,8395 (0,8); 3,8078 (16,0); 3,5501 (1,1); 3,5315 (3,5); 3,5132 (3,6); 3,4949 (1,1); 3,3120 (69,8); 3,2882 (0,8); 2,6741 (1,3); 2,6697 (1,7); 2,6650 (1,2); 2,5095 (98,6); 2,5051 (197,3); 2,5006 (262,9); 2,4961 (188,4); 2,4917 (86,5); 2,3320 (1,2); 2,3276 (1,6); 2,3229 (1,2); 2,0733 (1,3); 1,3198 (3,9); 1,3012 (8,4); 1,2827 (3,7); 1,2071 (3,8); 1,1888 (8,5); 1,1704 (3,6); 0,1460 (0,6); 0,0079 (6,4); -0,0001 (141,3); -0,0084 (4,6); -0,1494 (0,6)

Ví dụ I-035:

¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 10,6975 (2,4); 9,7086 (4,0); 9,5474 (0,4); 8,8950 (1,9); 8,8699 (5,5); 8,6344 (0,3); 8,6057 (2,3); 8,6021 (2,2); 8,0868 (1,3); 8,0810 (1,3); 8,0633 (1,2); 8,0578 (1,3); 3,8067 (0,7); 3,7884 (1,8); 3,7695 (16,0); 3,7485 (2,2); 3,3276 (21,3); 2,6706 (1,0); 2,5103 (58,2); 2,5061 (120,0); 2,5017 (162,4); 2,4972 (118,4); 2,4930 (56,9); 2,3332 (0,8); 2,3287 (1,0); 2,3241 (0,7); 2,1891 (12,6); 2,1725 (1,7); 1,2815 (3,5); 1,2631 (7,8); 1,2443 (4,0); 1,2246 (0,5); 0,1460 (0,4); 0,0078 (4,0); -0,0003 (99,9); -0,0084 (4,1); -0,1496 (0,5)

Ví dụ I-036:

¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,6509 (4,5); 8,9438 (2,1); 8,9199 (2,3); 8,8741 (2,5); 8,8708 (2,5); 8,6133 (2,6); 8,6094 (2,6); 8,0980 (2,3); 8,0912 (2,5); 7,9467 (1,6); 7,9398 (1,4); 7,9229 (1,5); 7,9160 (1,4); 5,1267 (0,9); 5,1049 (2,8); 5,0831 (2,9); 5,0611 (1,0); 3,8293 (0,6); 3,8112 (1,7); 3,7925 (1,9); 3,7764 (16,0); 3,3251 (26,1); 2,5062 (26,6); 2,5019 (35,5); 2,4976 (26,1); 2,0754 (0,6); 1,2811 (3,7); 1,2626 (8,0); 1,2441 (3,6); 0,0073 (1,0); -0,0003 (20,8); -0,0084 (0,8)

Ví dụ I-037:

¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,7668 (4,3); 8,8939 (2,1); 8,8817 (2,4); 8,8781 (2,5); 8,8707 (2,4); 8,8192 (2,8); 8,8139 (2,8); 8,6229 (2,4); 8,6188 (2,4); 8,3169 (1,9); 8,3115 (1,6); 8,2937 (1,6); 8,2883 (1,6); 3,8456 (0,6); 3,8273 (1,7); 3,8089 (1,7); 3,7826 (16,0); 3,3267 (59,1); 2,6762 (0,5); 2,6718 (0,6); 2,6672 (0,5); 2,5250 (2,9); 2,5116 (40,5); 2,5073 (77,5); 2,5028 (99,5); 2,4983 (72,9); 2,4940 (36,0); 2,3340 (0,4); 2,3297 (0,6); 2,3251 (0,4); 1,2897 (3,7); 1,2712 (8,1); 1,2527 (3,6); 0,0078 (2,9); -0,0002 (70,8); -0,0084 (2,9)

Ví dụ I-038:

¹H-NMR(400,2 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 10,9573 (2,7); 9,6777 (4,2); 8,9000 (1,8); 8,8761 (2,1); 8,8684 (4,3); 8,8635 (5,0); 8,6010 (2,5); 8,1237 (1,4); 8,1180 (1,4); 8,1002 (1,4); 8,0947 (1,5); 6,5510 (0,6); 3,8098 (0,6); 3,7911 (1,6); 3,7687 (16,0); 3,3258 (97,0); 3,3019 (0,8); 2,6747 (1,2); 2,6704 (1,6); 2,6658 (1,3); 2,5102 (98,7); 2,5059 (201,3); 2,5014 (270,0); 2,4970 (192,7); 2,4928 (89,5); 2,3329 (1,2); 2,3284 (1,5); 2,3241 (1,2); 2,0754 (1,0); 1,9325 (0,7); 1,9171 (1,0); 1,9007 (0,8); 1,2836 (3,6); 1,2651 (7,7); 1,2466 (3,5); 0,9228 (6,7); 0,9087 (3,8); 0,1460 (0,8); 0,0617 (0,4); 0,0079 (7,4); -0,0002 (149,5); -0,0085 (3,8); -0,1493 (0,6)

Ví dụ I-039:

¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,8713 (4,4); 8,9241 (2,8); 8,7317 (6,9); 8,6063 (2,4); 8,5771 (2,7); 8,1540 (1,9); 8,1477 (2,0); 8,1248 (1,7); 8,1185 (1,7); 3,9482 (16,0); 3,8436 (0,8); 3,8187 (2,2); 3,7939 (2,3); 3,7694 (0,8); 3,3189 (131,6); 2,7267 (0,5); 2,7212 (0,4); 2,5124 (30,8); 2,5068 (60,4); 2,5010 (80,0); 2,4953 (56,9); 2,2709 (0,5); 2,2645 (0,4); 2,0744 (0,4); 1,2894 (3,8); 1,2648 (8,3); 1,2401 (3,8); 0,0105 (1,4); -0,0004 (31,1); -0,0114 (1,1)

Ví dụ I-041:

¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,9704 (5,0); 9,0807 (2,0); 9,0505 (2,1); 8,7883 (2,8); 8,7337 (6,4); 8,3417 (1,7); 8,3071 (1,6); 7,6107 (1,0); 7,4261 (2,6); 7,2423 (1,3); 4,1955 (0,8); 3,9911 (0,4); 3,9621 (16,0); 3,8182 (0,9); 3,7934 (2,7); 3,7689 (2,8); 3,7463 (1,0); 3,7237 (0,3); 3,3204 (58,1); 3,2971 (1,5); 2,7289 (0,5); 2,5018 (61,7); 2,2704 (0,4); 1,4777 (0,4); 1,4536 (0,5); 1,2922 (4,0); 1,2676 (8,7); 1,2430 (4,4); 0,8584 (0,5); -0,0002 (16,9); -0,0652 (0,7)

Ví dụ I-042:

¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,9489 (4,0); 9,1291 (2,1); 8,7348 (7,1); 8,7081 (1,6); 8,6799 (1,8); 8,2286 (1,4); 8,2004 (1,3); 7,6419 (1,0); 7,4584 (2,2); 7,2752 (1,0); 4,0411 (0,5); 4,0174 (0,5); 3,9597 (16,0); 3,8374 (0,7); 3,8127 (2,3); 3,7880 (2,3); 3,7634 (0,8); 3,3178

(39,8); 3,2943 (0,4); 2,5135 (12,0); 2,5076 (23,5); 2,5016 (31,1); 2,4956 (21,2); 2,4898 (9,6); 1,9888 (2,1); 1,2988 (3,8); 1,2741 (8,4); 1,2494 (4,0); 1,2344 (1,6); 1,1984 (0,7); 1,1747 (1,2); 1,1510 (0,6); 0,8599 (0,4); 0,0106 (1,0); -0,0003 (23,8); -0,0114 (0,8)

Ví dụ I-043:

¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,4720 (3,2); 9,0229 (1,6); 8,9997 (1,8); 8,4069 (2,2); 8,4017 (2,2); 8,1789 (5,3); 8,1307 (1,6); 8,1254 (1,5); 8,1075 (1,5); 8,1022 (1,4); 7,2618 (17,6); 5,3010 (0,9); 4,0692 (16,0); 3,7645 (0,6); 3,7458 (1,9); 3,7272 (2,0); 3,7085 (0,6); 1,5597 (8,4); 1,4681 (3,6); 1,4494 (7,7); 1,4307 (3,5); 1,2547 (0,6); 0,0079 (0,5); -0,0002 (18,5); -0,0086 (0,5)

Ví dụ I-044:

¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 9,7533 (4,1); 9,6049 (0,3); 8,7487 (0,5); 8,7092 (7,1); 8,6694 (2,4); 8,4435 (2,0); 8,4155 (2,3); 7,9316 (1,5); 7,9276 (1,5); 7,9035 (1,3); 7,8996 (1,4); 4,1333 (1,0); 3,9515 (0,6); 3,9363 (16,0); 3,7824 (0,7); 3,7576 (2,1); 3,7329 (2,2); 3,7084 (0,8); 3,3239 (29,5); 2,6913 (9,7); 2,6365 (0,8); 2,5145 (13,8); 2,5086 (27,0); 2,5026 (35,8); 2,4967 (24,6); 2,4910 (11,2); 1,9895 (0,5); 1,4080 (0,6); 1,2746 (3,9); 1,2499 (9,2); 1,2341 (1,6); 1,2253 (3,9); 0,8815 (0,4); 0,8704 (0,5); 0,8596 (1,4); 0,8360 (0,5); -0,0005 (5,4)

Ví dụ I-045:

¹H-NMR(300,1 Mhz, d₆-DMSO):

δ= 10,0279 (5,0); 9,3059 (3,4); 8,8110 (2,0); 8,7825 (2,3); 8,7466 (6,3); 8,3878 (2,1); 8,3593 (1,8); 4,2371 (0,5); 3,9657 (16,0); 3,8923 (1,1); 3,8681 (3,0); 3,8435 (3,0); 3,8190 (1,1); 3,3203 (25,8); 2,5034 (18,1); 1,9896 (0,9); 1,3009 (4,1); 1,2764 (8,4); 1,2517 (4,1); 1,1756 (0,5); -0,0008 (4,1)

Ví dụ I-046:

¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,9980 (3,2); 9,9959 (3,2); 9,1242 (1,6); 9,1222 (1,0); 9,1042 (1,0); 9,1022 (1,7); 9,1002 (1,0); 8,1837 (5,1); 8,1787 (1,6); 8,1768 (1,7); 8,1598 (1,8); 8,1579 (1,7); 7,9011 (1,5); 7,8821 (1,4); 7,8791 (1,6); 7,8601 (1,3); 7,2617 (21,2); 4,0855 (16,0); 3,7785 (0,7); 3,7598 (2,2); 3,7411 (2,2); 3,7225 (0,7); 1,5610 (4,0); 1,4792 (3,5); 1,4605 (7,6); 1,4418 (3,4); 1,2543 (0,7); 0,0080 (0,7); -0,0002 (23,8); -0,0085 (0,8)

Ví dụ I-048:

¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,4231 (3,8); 9,1422 (1,8); 9,1185 (1,9); 8,6991 (1,9); 8,6948 (2,0); 8,2512 (2,1); 8,2466 (2,1); 7,7385 (1,4); 7,7316 (1,5); 7,7146 (1,4); 7,7077 (1,5); 7,4702 (2,2); 7,4634 (2,1); 7,2617 (33,3); 5,3006 (1,4); 4,6381 (1,1); 4,6185 (3,4); 4,5990 (3,5); 4,5793 (1,2); 3,9036 (0,6); 3,8955 (16,0); 3,8138 (0,7); 3,7952 (2,0); 3,7765 (2,0); 3,7579 (0,7); 1,5666 (7,8); 1,4601 (3,6); 1,4509 (0,4); 1,4414 (7,6); 1,4227 (3,5); 1,2543 (0,4); 0,0078 (1,0); -0,0002 (30,5); -0,0084 (1,0)

Ví dụ I-049:

¹H-NMR(600,1 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,4141 (0,6); 8,6958 (0,3); 8,6928 (0,3); 8,2481 (0,3); 8,2451 (0,3); 7,4466 (0,4); 7,4420 (0,4); 7,2606 (13,6); 4,4366 (0,3); 4,4299 (0,3); 3,8924 (2,8); 1,5473 (16,0); 1,4500 (0,6); 1,4376 (1,3); 1,4251 (0,6); 0,0053 (0,3); -0,0001 (11,0); -0,0056 (0,3)

Ví dụ I-050:

¹H-NMR(400,2 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,4403 (3,0); 9,4390 (3,0); 9,4051 (2,8); 9,0384 (1,5); 9,0151 (1,6); 8,9991 (1,3); 8,9764 (1,4); 8,7068 (1,6); 8,7024 (1,7); 8,6886 (1,5); 8,6840 (1,5); 8,3711 (2,0); 8,3659 (2,1); 8,2571 (1,7); 8,2522 (1,8); 8,2458 (1,6); 8,2413 (1,6); 8,0944 (1,5); 8,0892 (1,4); 8,0712 (1,4); 8,0659 (1,4); 7,8421 (1,6); 7,8379 (1,7); 7,7104 (1,1); 7,7056 (1,0); 7,6877 (1,1); 7,6828 (1,0); 7,2617 (50,2); 7,2547 (0,4); 5,3007 (13,0); 3,9032 (16,0); 3,8840 (14,5); 3,8348 (0,6); 3,8159 (1,8); 3,7973 (1,9); 3,7784 (1,0); 3,7590 (1,3); 3,7404 (1,4); 3,7218 (0,5); 2,2154 (0,4); 2,2071 (0,4); 2,1945 (0,8); 2,1823 (0,4); 2,1736 (0,4); 1,5656 (22,2); 1,4682 (3,4); 1,4497 (9,9); 1,4313 (9,4); 1,4128 (3,0); 1,2484 (0,6); 1,2360 (1,3); 1,2316 (1,5); 1,2197 (0,8); 1,2150 (1,4); 1,2107 (1,3); 1,1988 (0,6); 0,9640 (0,6); 0,9518 (1,9); 0,9479 (1,5); 0,9395 (1,4); 0,9353 (1,9); 0,9227 (0,5); 0,0079 (1,4); 0,0054 (0,8); -0,0002 (54,1); -0,0086 (1,8)

Ví dụ I-051:

¹H-NMR(600,1 Mhz, CDCl₃):

δ= 9,6302 (3,0); 9,2859 (1,6); 9,2708 (1,7); 8,6243 (1,9); 8,6220 (1,8); 8,1931 (4,9); 8,1822 (1,4); 8,1793 (1,4); 8,1672 (1,4); 8,1643 (1,3); 7,4328 (0,4); 7,2611 (62,0); 7,0843 (0,3); 4,0972 (14,7); 3,8086 (0,6); 3,7961 (1,6); 3,7837 (1,6); 3,7712 (0,6); 1,6064 (0,4); 1,5998 (0,5); 1,5953 (0,6); 1,5907 (0,7); 1,5580 (16,0); 1,4877 (3,3); 1,4826 (0,5); 1,4753 (7,0); 1,4628 (3,3); 1,4236 (0,4); 1,4113 (0,7); 1,4045 (0,6); 1,3997 (0,3); 1,3931 (0,5); 1,2884 (0,3); 1,2724 (0,6); 1,2553 (1,8); 1,2400 (0,5); 1,2327 (0,4); 1,2276 (0,7); 1,2204 (0,4); 1,2153 (0,4); 0,8804 (0,3); 0,0053 (2,0); -0,0001 (47,0); -0,0057 (0,9)

Ví dụ I-052:

¹H-NMR(600,1 Mhz, CDCl₃):

δ= 10,0378 (3,4); 10,0364 (3,3); 9,0710 (0,9); 9,0697 (0,9); 9,0641 (0,9); 9,0622 (1,4); 9,0549 (1,0); 9,0535 (0,9); 8,1834 (5,3); 8,0146 (0,4); 7,9722 (0,4); 7,9664 (4,8); 7,9595 (3,0); 7,9569 (2,8); 7,2625 (8,0); 5,3001 (0,6); 4,1985 (1,2); 4,0839 (16,0); 3,7674 (0,7); 3,7549 (1,9); 3,7425 (1,9); 3,7300 (0,7); 1,5803 (5,2); 1,4727 (3,7); 1,4602 (7,7); 1,4478 (3,6); 1,4050 (0,5); 1,3377 (0,5); 1,3061 (0,4); 1,2554 (0,8); 0,0710 (0,5); -0,0001 (5,9)

Ví dụ I-053:

¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):

δ= 9,6479 (4,2); 8,9210 (2,0); 8,8971 (2,1); 8,8058 (2,3); 8,8012 (2,5); 8,5703 (2,5); 8,5657 (2,4); 8,0391 (2,1); 8,0322 (6,0); 7,9134 (6,0); 7,9065 (1,4); 7,8896 (1,5); 7,8827 (1,4); 5,7626 (0,8); 4,6360 (1,4); 4,6046 (3,0); 4,5730 (0,3); 3,8204 (0,4); 3,8018 (0,7); 3,7784 (16,0); 3,3380 (24,2); 2,5119 (0,7); 2,5076 (13,8); 2,5032 (18,6); 2,4987 (13,5); 2,4944 (6,4); 1,8855 (0,4); 1,8373 (5,3); 1,7890 (2,6); 1,2761 (3,5); 1,2576 (0,3); 1,2390 (3,6); -0,0011 (4,8)

Ví dụ sử dụng

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

Đối với lớp phủ của các ống thử nghiệm, 9 mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 µl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của ống thủy tinh thể tích 25 ml bằng cách xoay và lắc trên máy lắc quỹ đạo (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7cm², dựa trên sự phân bố đồng đều, đạt được liều theo diện tích là 5µg/cm².

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

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Ctenocephalides felis* tốt nếu đạt được hiệu quả ít nhất 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm². Hiệu quả 100% có nghĩa là toàn bộ bọ chết bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là không có bọ chết nào bị tổn hại.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất dưới đây từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm² (=500 g/ha): I-005, I-025, I-032, I-034, I-037.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất dưới đây từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm² (=500 g/ha): I-012.

Rhipicephalus sanguineus - thử nghiệm tiếp xúc trong vitro với tích trưởng thành gây hại chó nâu

Đối với lớp phủ của các ống thử nghiệm, 9 mg hoạt chất trước tiên được hòa tan trong 1ml axeton p.a. và sau đó được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng axeton p.a. Lượng 250 µl dung dịch được phân bố đồng đều lên các thành bên trong và đáy của

ống thủy tinh thể tích 25 ml bằng cách xoay và lắc trên máy lắc quỹ đạo (quay lắc với tốc độ 30 vòng/phút trong thời gian 2 giờ). Với 900 ppm dung dịch hoạt chất và diện tích bề mặt bên trong 44,7cm², dựa trên sự phân bố đồng đều, đạt được liều theo diện tích là 5µg/cm².

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

Một chất thể hiện hiệu quả chống lại *Rhipicephalus sanguineus* tốt nếu đạt được hiệu quả ít nhất 80% trong thử nghiệm này với tỷ lệ áp dụng 5µg/cm². Hiệu quả 100% có nghĩa là toàn bộ tích bị chết hoặc gần chết. Hiệu quả 0% có nghĩa là không có con tích nào bị tổn hại.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ phần Ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 5 µg/cm²: I-032, I-037.

Boophilus microplus – Thử nghiệm tiêm

Dung môi: Dimetyl sulfoxit

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

1µl dung dịch hoạt chất được tiêm vào trong bụng của 5 con tích cái trưởng thành hút căng máu gây hại gia súc (*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 80% với tỷ lệ áp dụng là 20 µg/con: I-010.

Ctenocephalides felis - thử nghiệm uống

Dung môi: Dimetyl sulfoxit

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

Khoảng 20 bọ 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 bọ chết hút qua màng parafilm.

Sau 2 ngày, tỷ lệ chết theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả số bọ chết đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có bọ 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-005, I-008, I-010, I-012, I-013, I-025, I-034, I-037.

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 100 ppm: I-003, I-024.

Thử nghiệm với *Lucilia cuprina*

Dung môi: Dimetyl sulfoxit

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

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

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

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ bào chế thể hiện hiệu quả là 100% với tỷ lệ phun là 20ppm: I-010, I-034.

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 khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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 bọ 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 từ phần ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng 160 µg/khoang: I-004, I-006, I-016, I-018, I-019, I-020, I-025, I-027, I-029, I-030, I-031, I-039, I-041, I-042, I-043, I-044, I-045, I-046, I-048, I-050, I-051, I-052, I-053.

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-005, I-028, I-049.

Thử nghiệm với *Meloidogyne incognita*

Dung môi: 125,0 phần khối lượng axeton

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng của hoạt chất được trộn với lượng dung môi đã định và dịch cô đặc được pha loãng tới nồng độ mong muốn bằng nước.

Các bình được đổ đầy bằng cát, dung dịch hoạt chất, huyền phù chứa trứng/ấu trùng của tuyến trùng nốt sùng (*Meloidogyne incognita*) và hạt rau diếp. Các hạt rau diếp nảy mầm và cây lớn lên. Các nốt sần phát triển ở rễ.

Sau 14 ngày, hiệu quả diệt giun tròn tính theo % được xác định bằng mức độ tạo thành các nốt sần. 100% có nghĩa là không phát hiện được nốt sần nào; 0% có nghĩa là số nốt sần ở thực vật được xử lý tương ứng với mẫu đối chứng không được xử lý.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 100% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: I-008, I-027, I-041.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả 90% với tỷ lệ áp dụng là 20 ppm: I-004, I-005, I-006, I-020, I-026, I-042.

Myzus persicae – thử nghiệm uống

Dung môi: 100 phần khối lượng axeton

Đề tạo ra chế phẩm thích hợp chứa hoạt chất, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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 hoạt chất được chuyển vào các đĩa vi chuẩn độ và pha đến thể tích cuối là 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 áp dụng là 4 ppm: I-001, I-002, I-003, I-004, I-005, I-007, I-008, I-010, I-012, I-013, I-015, I-016, I-018, I-019, I-020, I-021, I-022, I-024, I-025, I-027, I-028, I-029, I-030, I-031, I-032, I-033, I-034, I-035, I-036, I-037, I-038, I-039, I-041, I-042, I-043, I-044, I-045, I-046, I-051, I-052.

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 4 ppm: I-006, I-014, I-026, I-050.

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 khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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-006, I-010, I-013, I-014, I-018, I-026, I-032, I-037, I-042, I-045.

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-001, I-002, I-003, I-012, I-020, I-024, I-025, I-028, I-029, I-034, I-035, I-041, I-043, I-044.

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-027.

Phaedon cochleariae - thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 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 khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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-001, I-002, I-007, I-008, I-010, I-012, I-013, I-014, I-021, I-022, I-024, I-026, I-032, I-035, I-037, I-038.

Spodoptera frugiperda- thử nghiệm phun

Dung môi: 78,0 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 khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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-001, I-004, I-005, I-006, I-008, I-010, I-012, I-013, I-014, I-016, I-019, I-020, I-021, I-022, I-024, I-025, I-026, I-027, I-028, I-029, I-030, I-031, I-032, I-033, I-036, I-037, I-038, I-039, I-041, I-043, I-045, I-046, I-048, I-049, I-050, I-051, I-052, I-053.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 83% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-015, I-034, I-042.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả là 67% với tỷ lệ áp dụng là 100 g/ha: I-007.

Ví dụ so sánh

Myzus persicae - thử nghiệm phun (MYZUPE)

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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 cải bắp Trung Quốc (*Brassica pekinensis*) đã được gây nhiễm rệp đào xanh (*Myzus persicae*) ở tất cả các giai đoạn được phun bằng chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, hiệu quả theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả các con rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không con rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả vượt trội so với giải pháp kỹ thuật đã biết: xem trong bảng 1.

Spodoptera frugiperda – thử nghiệm phun (SPODFR)

Dung môi: 78,0 phần khối lượng axeton

1,5 phần khối lượng dimetylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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 xanh (*Spodoptera frugiperda*) được đưa vào.

Sau thời gian mong muốn, hiệu quả 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 đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả vượt trội so với giải pháp kỹ thuật đã biết: xem bảng 1.

Myzus persicae - thử nghiệm phun (MYZUPE S)

Dung môi: 14 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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. Nếu cần bổ sung muối amoni và/hoặc chất thấm, mỗi chất này được bổ sung với nồng độ 1000 ppm vào dung dịch chế phẩm.

Cây ớt chuông (*Capsicum annuum*) được gây nhiễm rệp đào xanh (*Myzus persicae*) ở mức nặng được xử lý bằng cách phun bằng chế phẩm chứa hoạt chất với nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, khả năng tiêu diệt theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả động vật đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không có động vật nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả vượt trội so với giải pháp kỹ thuật đã biết: xem bảng 1.

Myzus persicae - thử nghiệm dưỡng ẩm (MYZUPE D)

Dung môi: 7 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 2 phần khối lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được trộn với lượng xác định của dung môi và chất nhũ hóa, và thể đặc này được pha loãng bằng nước tới nồng độ mong muốn, nhất thiết phải bao gồm cả lượng đất trồng mà đất này được dưỡng ẩm theo tính toán. Cần bảo đảm rằng, không được vượt quá nồng độ 40 ppm chất nhũ hóa trong đất. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, nước được sử dụng để pha loãng.

Bắp cải Savoy (*Brassica oleracea*) trong các chậu chứa đất và được gây nhiễm bằng rệp đào xanh mọi giai đoạn (*Myzus persicae*) được tưới bằng chế phẩm chứa hoạt chất với nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, hiệu quả theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả các con rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không con rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả vượt trội so với giải pháp kỹ thuật đã biết: xem bảng 1.

Aphis gossypii – thử nghiệm phun (APHIGO S)

Dung môi: 14 phần khối lượng dimethylformamit

Chất nhũ hóa: alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm chứa hoạt chất thích hợp, 1 phần khối lượng hoạt chất được hòa tan vào các phần khối 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. Nếu cần bổ sung muối amoni và/hoặc chất thấm, mỗi chất này được bổ sung với nồng độ 1000 ppm vào dung dịch chế phẩm.

Thực vật bông (*Gossypium hirsutum*) gây nhiễm nặng bằng rệp hại bông (*Aphis gossypii*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất với nồng độ mong muốn.

Sau thời gian mong muốn, khả năng tiêu diệt theo % được xác định. 100% có nghĩa là tất cả các con rệp đã bị tiêu diệt; 0% có nghĩa là không con rệp nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hiệu quả vượt trội so với giải pháp kỹ thuật đã biết: xem bảng 1.

Thử nghiệm sâu keo mùa thu (*Spodoptera frugiperda*) (SPODFR S)

Dung môi: 14 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 2 phần khối lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm thích hợp của hoạt chất, 1 phần khối lượng của hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng xác định của dung môi và chất nhũ hóa và tạo ra nồng độ mong muốn bằng nước. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, nước được sử dụng để pha loãng. Trong trường hợp việc bổ sung các muối amoni hoặc/và các chất thấm (dầu hạt nho metyl este) là cần thiết, mỗi chất này được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch chế phẩm hoàn thiện đã được pha loãng.

Cây ngô (*Zea mays*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn và, trong mỗi trường hợp sau 5, 12 và 19 ngày, 5 con ngài (L2) sâu keo mùa thu (*Spodoptera frugiperda*) được đưa vào.

Tỷ lệ tiêu diệt được xác định 6 ngày sau khi làm nhiễm. 100% có nghĩa là, toàn bộ số con ngài đã bị tiêu diệt và 0% có nghĩa là không có con ngài nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hoạt tính tốt: xem bảng 2.

Thử nghiệm sâu đục thân bông (*Heliothis armigera*) (HELIAR S)

Dung môi: 14 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 2 phần khối lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm thích hợp của hoạt chất, 1 phần khối lượng của hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng xác định của dung môi và chất nhũ hóa và tạo ra nồng độ mong muốn bằng nước. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, nước được sử dụng để pha loãng. Trong trường hợp việc bổ sung các muối amoni hoặc/và các chất thấm (dầu hạt nho metyl este) là cần thiết, mỗi chất này được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch chế phẩm hoàn thiện đã được pha loãng.

Cây bông (*Gossypium hirsutum*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất ở nồng độ mong muốn và, trong mỗi trường hợp sau 12 và 19 ngày, 5 con ngài (L2) sâu đục quả bông (*Heliothis armigera*) được đưa vào.

Tỷ lệ tiêu diệt được xác định 6 ngày sau khi làm nhiễm. 100% có nghĩa là, toàn bộ số con ngài đã bị tiêu diệt và 0% có nghĩa là không có con ngài nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hoạt tính tốt: xem bảng 2.

Thử nghiệm *Plutella xylostella* (PLUTMA S)

Dung môi: 14 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 2 phần khối lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm thích hợp của hoạt chất, 1 phần khối lượng của hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng xác định của dung môi và chất nhũ hóa và tạo ra nồng độ mong muốn bằng nước. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, nước được sử dụng để pha loãng. Trong trường hợp việc bổ sung các muối amoni hoặc/và các chất thấm (dầu hạt nho methyl este) là cần thiết, mỗi chất này được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch chế phẩm hoàn thiện đã được pha loãng.

Cây cải bắp (*Brassica oleracea* var. *sabauda*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất với nồng độ mong muốn và, sau 19 ngày, 10 con ngài (ấu trùng L2) sâu tơ (*Plutella xylostella*) được đưa vào.

Tỷ lệ tiêu diệt được xác định 6 ngày sau khi làm nhiễm. 100% có nghĩa là, toàn bộ số con ngài đã bị tiêu diệt và 0% có nghĩa là không có con ngài nào bị tiêu diệt.

Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hoạt tính tốt: xem bảng 2.

Thử nghiệm *Phaedon cochleariae* (PHAECO S)

Dung môi: 14 phần theo khối lượng của dimethylformamit

Chất nhũ hóa: 2 phần khối lượng alkylaryl polyglycol ete

Để tạo ra chế phẩm thích hợp của hoạt chất, 1 phần khối lượng của hoạt chất được hòa tan với các phần khối lượng xác định của dung môi và chất nhũ hóa và tạo ra nồng độ mong muốn bằng nước. Để tạo ra các nồng độ thử nghiệm khác, nước được sử

dụng để pha loãng. Trong trường hợp việc bổ sung các muối amoni hoặc/và các chất thấm (dầu hạt nho metyl este) là cần thiết, mỗi chất này được hút bằng pipet với nồng độ 1000 ppm sau khi dung dịch chế phẩm hoàn thiện đã được pha loãng.

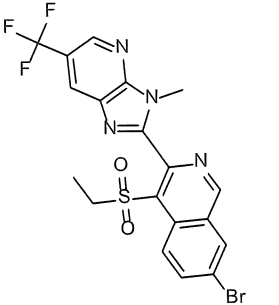
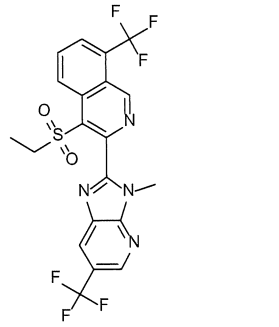
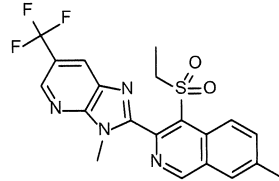
Cây cải bắp (*Brassica oleracea* var. *sabauda*) được phun chế phẩm chứa hoạt chất có nồng độ mong muốn và 10 ấu trùng L2 của bọ cánh cứng mù tạc (*Phaedon cochleariae*) được đưa vào.

Sau thời gian mong muốn, khả năng tiêu diệt theo % được xác định. 100% có nghĩa là, toàn bộ ấu trùng đã bị tiêu diệt và 0% có nghĩa là, không có ấu trùng nào bị tiêu diệt.

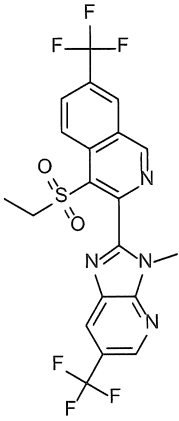
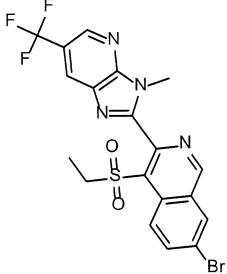
Trong thử nghiệm này, ví dụ, các hợp chất sau đây từ các ví dụ điều chế thể hiện hoạt tính tốt: xem bảng 2.

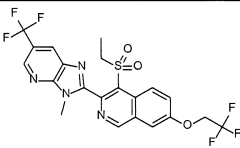
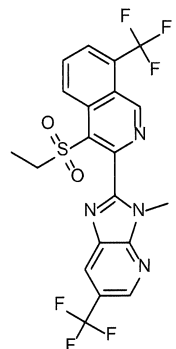
Bảng 1:

Hợp chất	Cấu trúc	Mục đích	Nồng độ	% Hiệu lực
I-51 đã biết từ WO 2017/0720 39		SPODFR	0,8 g hoạt	67 7 ngày sau khi
		MYZUPE	chất/ha	xử lý
			20 g hoạt	0 5 ngày sau khi
		MYZUPE S	chất/ha	xử lý
			4 g hoạt	0 5 ngày sau khi
		MYZUPE D	chất/ha	xử lý
		APHIGO S	4 ppm	70 6 ngày sau khi
			0,8 ppm	xử lý
			4 ppm	0 6 ngày sau khi
			4 ppm	xử lý
				0 10 ngày sau khi
				xử lý
				20 6 ngày sau khi
				xử lý

I-037 theo sáng chế		SPODFR MYZUPE MYZUPE S MYZUPE D APHIGO S	0,8 g hoạt chất/ha 20 g hoạt chất/ha 4 g hoạt chất/ha 4 ppm 0,8 ppm 4 ppm 4 ppm	100 7 ngày sau khi xử lý 90 5 ngày sau khi xử lý 70 5 ngày sau khi xử lý 100 6 ngày sau khi xử lý 100 6 ngày sau khi xử lý 90 10 ngày sau khi xử lý 65 6 ngày sau khi xử lý
I-032 theo sáng chế		SPODFR MYZUPE APHIGO S	0,8 g hoạt chất/ha 20 g hoạt chất/ha 4 g hoạt chất/ha 4 ppm	100 7 ngày sau khi xử lý 100 5 ngày sau khi xử lý 90 5 ngày sau khi xử lý 90 6 ngày sau khi xử lý
I-015 theo sáng chế		MYZUPE S APHIGO S	4 ppm 0,8 ppm 4 ppm	100 6 ngày sau khi xử lý 25 6 ngày sau khi xử lý 100 6 ngày sau khi xử lý

Bảng 2:

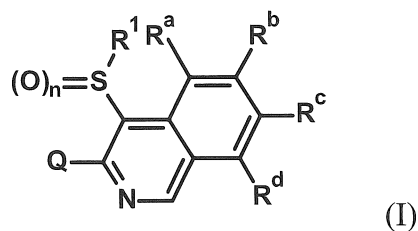
Hợp chất	Cấu trúc	Mục đích	Nồng độ	Gây nhiễm	% Hiệu lực
I-51 đã biết từ WO 2017/0720 39		PHAECO S	0,16 ppm	5 ngày sau	10 6 ngày sau
			0,8 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	12 ngày sau	40 6 ngày sau
		PLUTMA S	0,16 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	12 ngày sau	0 6 ngày sau
			0,8 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
		SPODFR S	0,16 ppm	12 ngày sau	50 6 ngày sau
			0,8 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	19 ngày sau	50 6 ngày sau
		HELIAR S	0,8 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	5 ngày sau	20 6 ngày sau
			0,16 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	12 ngày sau	80 6 ngày sau
				khi xử lý	khi gây nhiễm
				12 ngày sau	10 6 ngày sau
				khi xử lý	khi gây nhiễm
				19 ngày sau	60 6 ngày sau
				khi xử lý	khi gây nhiễm
I-037 theo sáng chế		PHAECO S	0,16 ppm	5 ngày sau	80 6 ngày sau
			0,8 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	12 ngày sau	100 6 ngày sau
		SPODFR S	0,16 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,8 ppm	12 ngày sau	60 6 ngày sau
			0,16 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
		HELIAR S	0,8 ppm	5 ngày sau	70 6 ngày sau
			0,16 ppm	khi xử lý	khi gây nhiễm
			0,16 ppm	12 ngày sau	100 6 ngày sau
				khi xử lý	khi gây nhiễm

				12 ngày sau khi xử lý	50 6 ngày sau khi gây nhiễm
				19 ngày sau khi xử lý	100 6 ngày sau khi gây nhiễm
				12 ngày sau khi xử lý	80 6 ngày sau khi gây nhiễm
				19 ngày sau khi xử lý	70 6 ngày sau khi gây nhiễm
I-036 theo sáng chế		PLUTMA S SPODFR S	0,16 ppm 0,16 ppm 0,8 ppm 0,16 ppm	19 ngày sau khi xử lý	80 6 ngày sau khi gây nhiễm
				5 ngày sau khi xử lý	90 6 ngày sau khi gây nhiễm
				19 ngày sau khi xử lý	100 6 ngày sau khi gây nhiễm
				19 ngày sau khi xử lý	70 6 ngày sau khi gây nhiễm
I-032 theo sáng chế		SPODFR S	0,16 ppm 0,8 ppm 0,16 ppm	5 ngày sau khi xử lý	100 6 ngày sau khi gây nhiễm
				12 ngày sau khi xử lý	100 6 ngày sau khi gây nhiễm
				12 ngày sau khi xử lý	70 6 ngày sau khi gây nhiễm

dat = ngày sau khi xử lý; dai = ngày sau khi gây nhiễm

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I)



trong đó

R¹ là etyl,

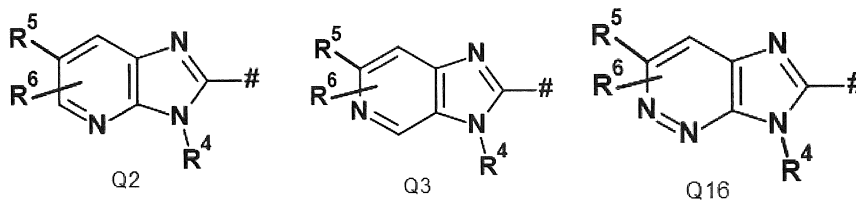
R^a là hydro,

R⁴ là metyl,

R⁶ là hydro,

n là 2,

Q là hệ vòng hai vòng dị thơm ngưng tụ có 9 cạnh từ nhóm bao gồm Q2, Q3 hoặc Q16



trong trường hợp Q là Q2, thì

R^b là hydro hoặc triflometyl,

R^c là hydro, clo, brom, xyano, metyl, xyclopropyl, metoxy, metyl(carbonyl)amino (-NH-CO-Me), xyclopropyl(carbonyl)amino (-NH-CO-xyclopropyl), metoxy(carbonyl)amino (-NH-CO-OMe), etylsulfonyl, 2,2-difloetoxy, 2,2,2-trifloetoxy, 2,2-diflopropoxy (-OCH₂CF₂CH₃) hoặc 2,2,2-trifloetylthio,

R^d là hydro, brom, clo, xyano hoặc triflometyl,

trong đó một trong các gốc R^b, R^c hoặc R^d là phần tử thể khác với hydro,

R⁵ là triflometyl, pentafloretyl, triflometoxy hoặc triflometylsulfonyl,

trong trường hợp Q là Q3, thì

R^b là hydro,

R^c là hydro,

R^d là brom, xyano, hoặc triflometyl,

R^5 là triflometyl hoặc pentafluetyl,

trong trường hợp Q là Q16, thì

R^b là hydro, metyl, diflometyl, triflometyl hoặc clo,

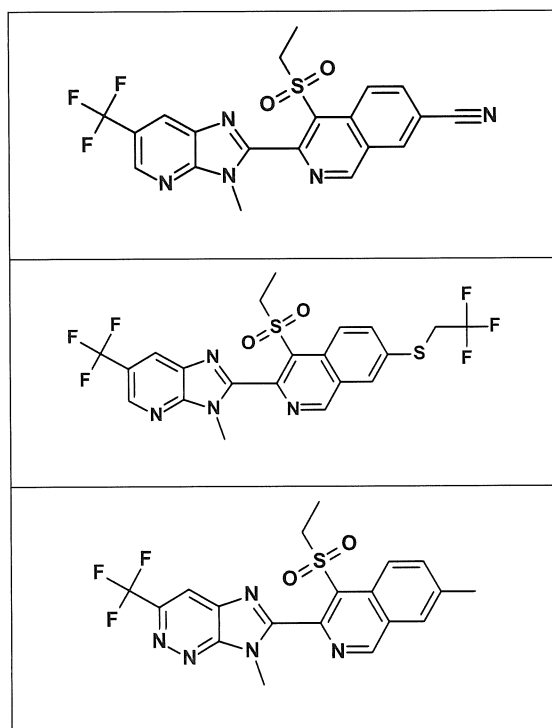
R^c là hydro, clo, brom, xyano, metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

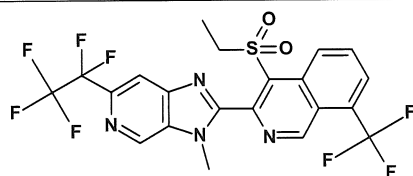
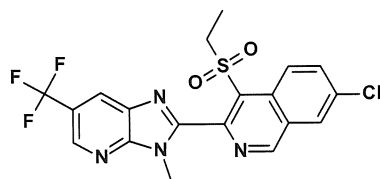
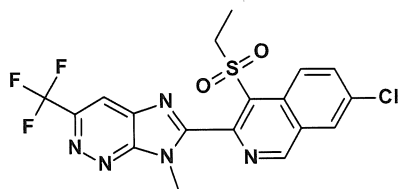
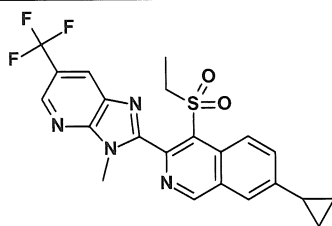
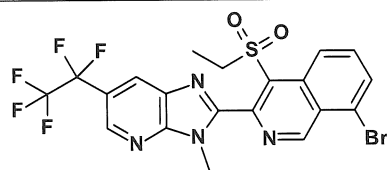
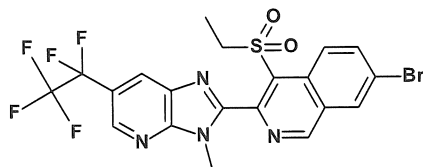
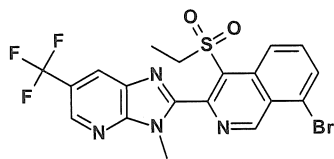
R^d là hydro, brom hoặc clo,

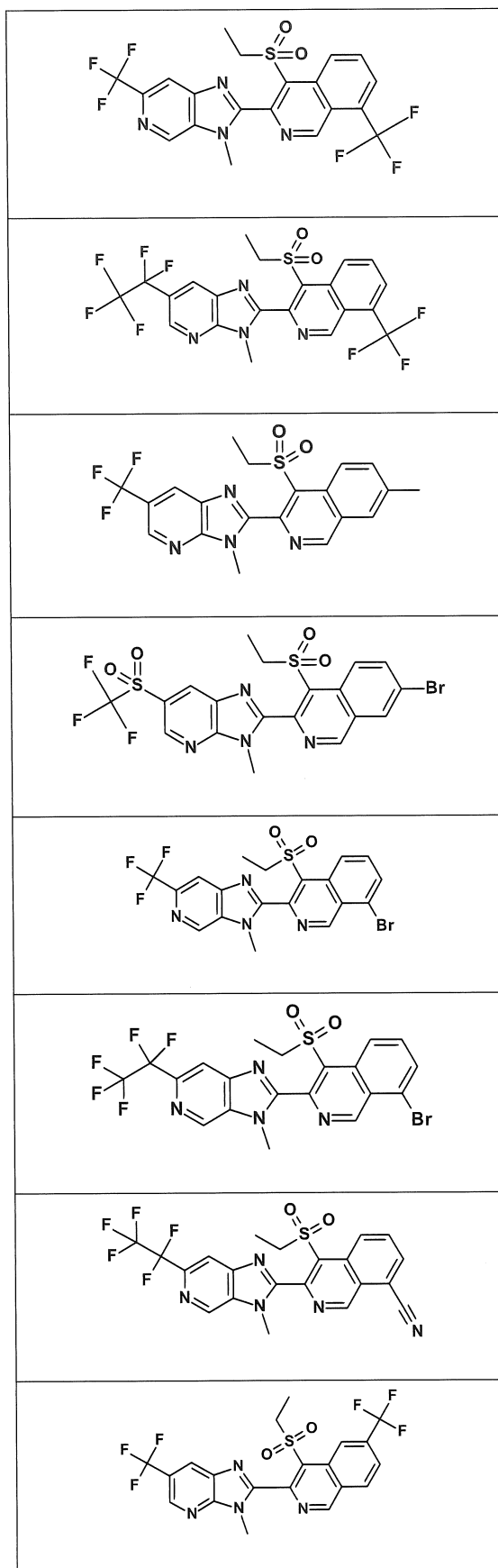
trong đó một trong các gốc R^b , R^c hoặc R^d là phần tử thế khác với hydro,

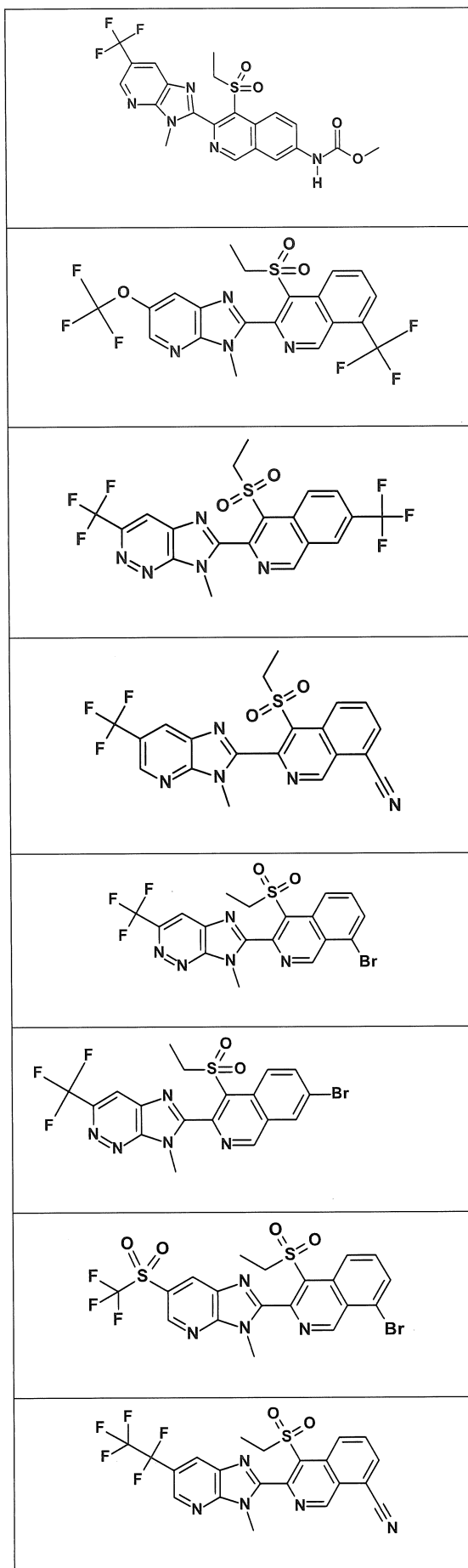
R^5 là triflometyl hoặc pentafluetyl.

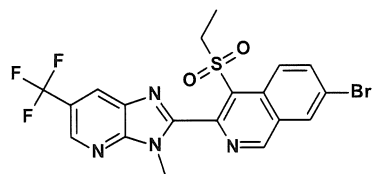
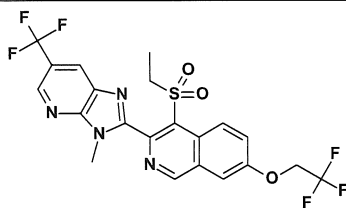
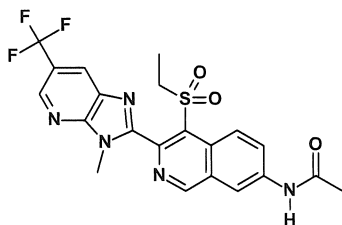
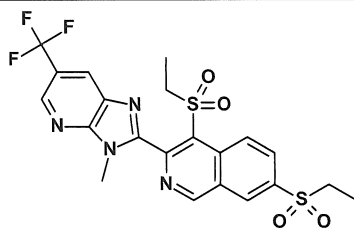
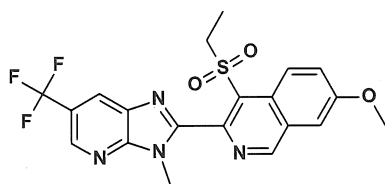
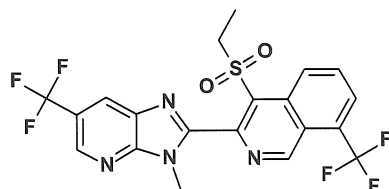
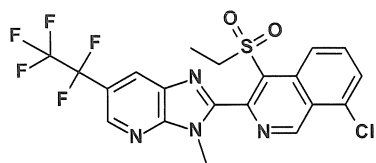
2. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó hợp chất này có công thức cấu tạo dưới đây:

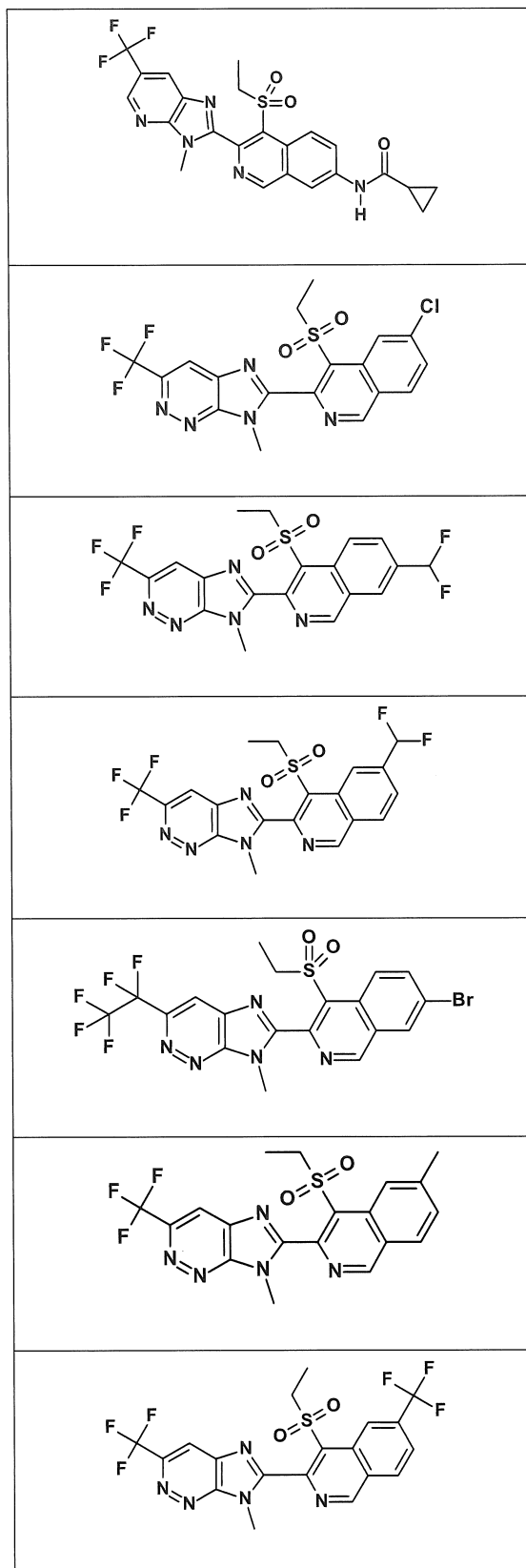


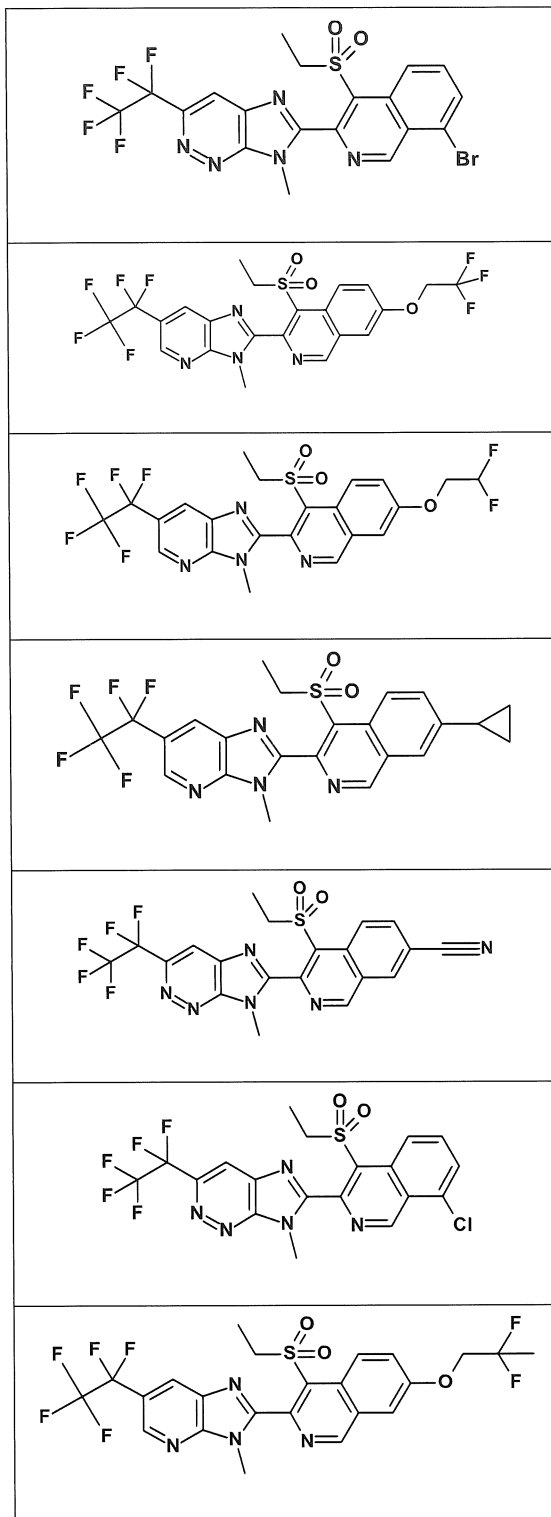












3. Chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 và các chất độn và/hoặc các chất hoạt động bề mặt.
4. Chế phẩm hóa nông theo điểm 3, còn chứa thêm hoạt chất có hoạt tính hóa nông khác.

5. 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 3 hoặc 4 được cho tác động lên động vật gây hại và/hoặc môi trường sống của chúng, loại trừ phương pháp điều trị bằng phẫu thuật hoặc trị liệu cho cơ thể người hoặc động vật.