



(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



1-0048575

(51)^{2020.01} C07D 498/14; A01P 7/04; A01N 43/90; (13) B
A01P 7/02

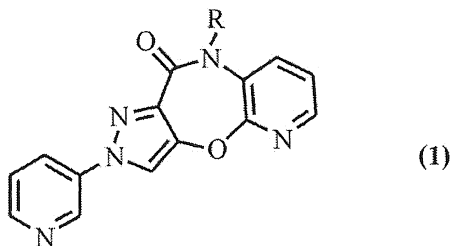
-
- (21) 1-2022-00469 (22) 06/08/2020
(86) PCT/JP2020/030107 06/08/2020 (87) WO2021/029308 18/02/2021
(30) 2019-147693 09/08/2019 JP; 2019-231507 23/12/2019 JP
(45) 25/07/2025 448 (43) 27/06/2022 411A
(73) NIHON NOHYAKU CO., LTD. (JP)
19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386, Japan
(72) HAYASHI Nobuyuki (JP); GOSHO Yoshinori (JP); AOSHIMA Masataka (JP);
SATO Hiroko (JP).
(74) Công ty TNHH Sở hữu trí tuệ Hải Hân (HAI HAN IP CO., LTD.)
-

(54) HỢP CHẤT OXAZEPINON, THUỐC TRỪ SÂU NÔNG NGHIỆP/NGHỀ LÀM
VƯỜN CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP SỬ DỤNG THUỐC TRỪ
SÂU NÀY

(21) 1-2022-00469

(57) Sáng chế đề cập đến thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn mới với ảnh hưởng có hại được giảm bớt cho động vật bao gồm con người trong sản xuất mùa vụ nông nghiệp, nghề làm vườn và mùa vụ khác. Sáng chế đề cập đến hợp chất, hoặc muối của chúng, được thể hiện bằng Công thức chung (1):

công thức 1



{trong công thức này, R là nhóm (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl}.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến hợp chất oxazepinon, thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn chứa hợp chất hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính của nó, cũng như phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Tài liệu sáng chế 1 bộc lộ rằng hợp chất oxazepinon thể hiện hoạt tính diệt côn trùng cao chống lại côn trùng gây hại trong lĩnh vực nông nghiệp/nghề làm vườn. Tuy nhiên, tài liệu này không mô tả về cấu trúc đặc trưng của hợp chất được đề xuất theo sáng chế, và cũng không mô tả về mức độ an toàn cao cho con người, v.v., có được nhờ hợp chất theo sáng chế.

Tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

Tài liệu sáng chế 1: Công bố quốc tế số 2016/027790

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề kỹ thuật

Côn trùng gây hại, v.v., vẫn đang gây ra phá hoại nghiêm trọng đến sản lượng của mùa vụ nông nghiệp, nghề làm vườn và mùa vụ khác, và vì lý do như sự xuất hiện của côn trùng gây hại mà kháng lại hóa chất hiện có, v.v., có nhu cầu phát triển thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn mới và thuốc diệt ve, bét. Ngoài ra, do mức độ quan tâm cao gần đây đối với sự an toàn cho mùa vụ nông nghiệp, có nhu cầu tạo ra thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn với ảnh hưởng có hại được giảm bớt cho động vật bao gồm con người.

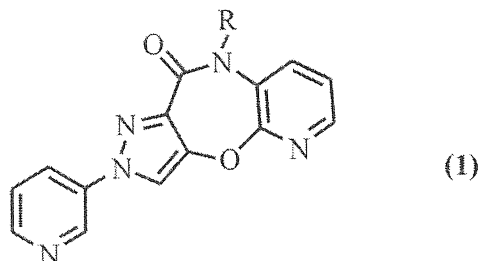
Giải pháp xử lý vấn đề

Thông qua nghiên cứu lặp lại một cách nghiêm túc để phát triển thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn mới, tác giả sáng chế phát hiện ra rằng hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế là thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn không chỉ có hiệu quả cao trong việc kiểm soát côn trùng gây hại

trong lĩnh vực nông nghiệp/nghề làm vườn mà còn có mức độ an toàn cao cho con người, v.v., và sáng chế được hoàn thành theo hướng đó.

Cụ thể là, sáng chế đề cập đến các đối tượng sau:

[1] hợp chất, hoặc muối của chúng, được thể hiện bằng Công thức chung (1):
công thức 1



{trong công thức này, R là nhóm (C_1 - C_6) alkoxy (C_1 - C_6) alkyl}.

[2] hợp chất, hoặc muối của chúng, theo mục [1] trên đây, trong đó R là nhóm metoxymetyl.

[3] thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn trong đó thuốc này chứa hợp chất hoặc muối của chúng theo mục [1] hoặc mục [2] trên đây, đóng vai trò là thành phần hoạt tính.

[4] phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn, khác biệt ở chỗ thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn theo mục [3] trên đây được áp dụng cho cây trồng hoặc đất bởi lượng hiệu quả.

[5] sử dụng hợp chất hoặc muối của chúng theo mục [1] hoặc mục [2] trên đây, làm thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong định nghĩa của Công thức chung (1) thể hiện hợp chất được đề xuất theo sáng chế,

"Nhóm (C_1 - C_6) alkyl" là, ví dụ, nhóm methyl, nhóm ethyl, nhóm propyl thông thường, nhóm isopropyl, nhóm butyl thông thường, nhóm isobutyl, nhóm butyl bậc hai, nhóm butyl bậc ba, nhóm pentyl thông thường, nhóm isopentyl, nhóm pentyl bậc ba, nhóm neopentyl, nhóm 2,3-dimethyl propyl, nhóm 1-ethyl propyl, nhóm 1-methyl butyl, nhóm 2-methyl butyl, nhóm hexyl thông thường, nhóm isohexyl, nhóm 2-hexyl, nhóm 3-hexyl, nhóm 2-methyl pentyl, nhóm 3-methyl pentyl, nhóm 1,1,2-trimethyl propyl, nhóm

3,3-dimetyl butyl, hoặc các nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh khác với số nguyên tử cacbon nằm trong khoảng từ 1 đến 6.

"Nhóm (C_1-C_6) alkoxy" là, ví dụ, nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm propoxy thông thường, nhóm isopropoxy, nhóm butoxy thông thường, nhóm butoxy bậc hai, nhóm butoxy bậc ba, nhóm pentyloxy thông thường, nhóm isopentyloxy, nhóm pentyloxy bậc ba, nhóm neopentyloxy, nhóm 2,3-dimetyl propyloxy, nhóm 1-etyl propyloxy, nhóm 1-metyl butyloxy, nhóm hexyloxy thông thường, nhóm isohehexyloxy, nhóm 1,1,2-trimetyl propyloxy, hoặc các nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh khác với số nguyên tử cacbon nằm trong khoảng từ 1 đến 6.

Mỗi ký hiệu " (C_1-C_6) ," " (C_2-C_6) ," " (C_3-C_6) ," v.v., là khoảng của số nguyên tử cacbon cho mỗi trong số các nhóm thể khác nhau. Định nghĩa nêu trên cũng áp dụng cho nhóm mà nhóm thể nêu trên đây liên kết với; ví dụ, "nhóm (C_1-C_6) alkoxy (C_1-C_6) alkyl" chỉ ra rằng nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh với số nguyên tử cacbon nằm trong khoảng từ 1 đến 6 được liên kết với nhóm alkyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh với số nguyên tử cacbon nằm trong khoảng từ 1 đến 6.

Muối của hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể là, ví dụ, muối hydroclorua, muối sunfat, muối nitrat, muối phosphat hoặc muối của axit vô cơ khác, muối axetat, muối fumarat, muối maleat, muối oxalat, muối metan sunfonat, muối benzen sunfonat, muối paratoluen sunfonat hoặc muối của axit hữu cơ khác, hoặc muối kết hợp với ion natri, ion kali, ion canxi, trimetyl amoni, hoặc bazơ vô cơ hoặc hữu cơ khác.

Hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể có một hoặc nhiều trung tâm không đối xứng, hoặc hai hoặc nhiều loại isome quang hoặc đồng phân phi đối hình, trong công thức cấu trúc của nó, và sáng chế đề cập đến isome quang riêng rẽ cũng như tất cả hỗn hợp chứa isome quang này ở bất kỳ tỷ lệ nào. Ngoài ra, hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể có hai loại isome hình học thu được từ liên kết đôi cacbon-cacbon trong công thức cấu trúc của nó, và sáng chế đề cập đến isome hình học riêng rẽ cũng như tất cả hỗn hợp chứa isome hình học này ở bất kỳ tỷ lệ nào.

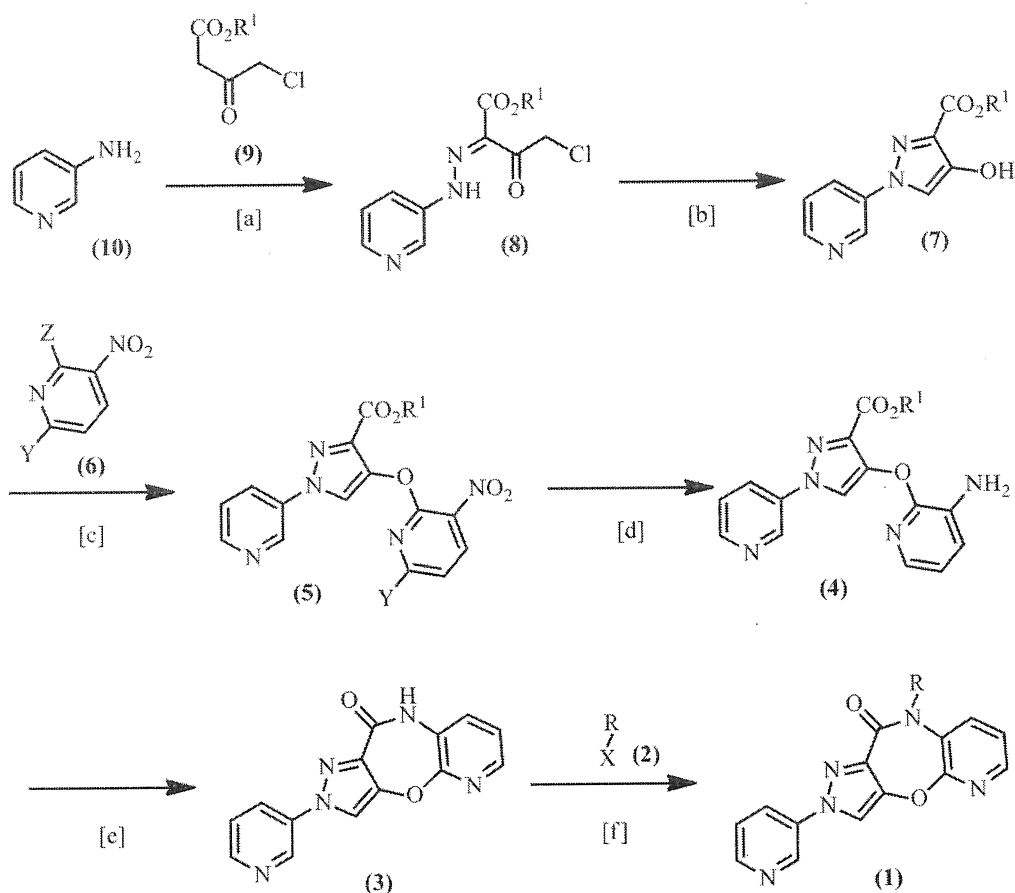
Phương án ưu tiên của hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được thể hiện dưới đây.

Tốt hơn, nếu R là nhóm metoxymetyl.

Ví dụ nhiều hợp chất khác nhau theo sáng chế có thể được sản xuất sử dụng phương pháp sản xuất dưới đây; tuy nhiên, sáng chế không bị giới hạn ở những ví dụ này.

Phương pháp sản xuất 1

công thức 2



{trong công thức này, R là giống như được đề cập đến trên đây, R¹ là nhóm (C₁-C₆) alkyl, X là nguyên tử halogen, nhóm metansulfonyloxy, nhóm paratoluensulfonyloxy, nhóm triflosulfonyl group hoặc các nhóm dôi chuyên khác, Y là nguyên tử hydro hoặc nguyên tử halogen, và Z là nguyên tử halogen.}

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể được sản xuất từ 3-aminopyridin được thể hiện bằng Công thức (10) sử dụng Bước [a], [b], [c], [d], [e], và [f] dưới đây.

Bước [a] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8) bằng cách đưa 3-aminopyridin được thể hiện bằng Công thức (10) đến giai đoạn diazo hóa, và sau đó làm cho sản phẩm thu được phản ứng với 4-cloaxeto axetat được thể hiện bằng Công thức (9).

Bước [b] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8) bằng phản ứng đóng vòng.

Bước [c] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (5) bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) phản ứng với hợp chất 3-nitropyridin được thể hiện bằng Công thức (6).

Bước [d] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4) bằng cách khử nhóm nitro của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (5), và cũng bằng cách khử "Y" trong công thức khi "Y" là nguyên tử halogen.

Bước [e] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3) từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4) bằng phản ứng đóng vòng.

Bước [f] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (2).

Phương pháp sản xuất của Bước [a]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8) có thể được sản xuất bằng cách cho 3-aminopyridin được thể hiện bằng Công thức (10) phản ứng với natri nitrit với sự có mặt của axit clohydric 6N cho việc diazo hóa, và sau đó bằng cách làm cho sản phẩm thu được phản ứng với 4-cloaxeto axetat được thể hiện bằng Công thức (9) với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, liti hydroxit, natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, hoặc các hydroxit khác; liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v., mà thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của 3-aminopyridin được thể hiện bằng Công thức (10).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác; metylen clorua, clorofom, cacbon tetraclorea, hoặc các hydrocacbon được halogen hóa khác; clorobenzen, diclorobenzen, hoặc các hydrocacbon thơm được halogen hóa khác; axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamid, N,N-dimetyl axetamid, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol hoặc các rượu khác; nước, v.v..., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của 3-aminopyridin được thể hiện bằng Công thức (10).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng mol, mỗi hợp chất chỉ cần được sử dụng với lượng mol cân bằng; tuy nhiên, hoặc hợp chất có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v..., và không cố định, có thể thường được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v..., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [b]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) có thể được sản xuất từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8) bằng phản ứng đóng vòng với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là liti diisopropylamid, liti hexametyldisilazan, natri hexametyldisilazan, hoặc các hợp chất cơ kim khác; natri

butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamid, N,N-dimetyl axetamid, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol hoặc các rượu khác, v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (8).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [c]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (5) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (6) với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ liti diisopropylamit, liti hexametyldisilazan, natri hexametyldisilazan, hoặc các hợp chất cơ kim khác; natri butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; liti hydroxit, natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, hoặc các hydroxit khác; liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamit, N,N-dimetyl axetamit, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v..., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng mol, mỗi hợp chất chỉ cần được sử dụng với lượng mol cân bằng; tuy nhiên, hoặc hợp chất có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v..., và không cố định, có thể thường được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v..., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [d]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4) có thể được sản xuất bằng cách khử nhóm nitro của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (5) bằng phản ứng khử bột sắt hoặc phản ứng hydrat hóa mà được sử dụng đóng vai trò là phương pháp thông thường trong hóa học hữu cơ tổng hợp.

Phương pháp sản xuất của Bước [e]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3) có thể được sản xuất từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4) bằng phản ứng đóng vòng với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là liti diisopropylamit, liti hexametyldisilazan, natri hexametyldisilazan, hoặc các hợp chất cơ kim khác; natri butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamit, N,N-dimetyl axetamit, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (4).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông

thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [f]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (2) với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là liti diisopropylamit, liti hexametyldisilazan, natri hexametyldisilazan, hoặc các hợp chất cơ kim khác; natri butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3).

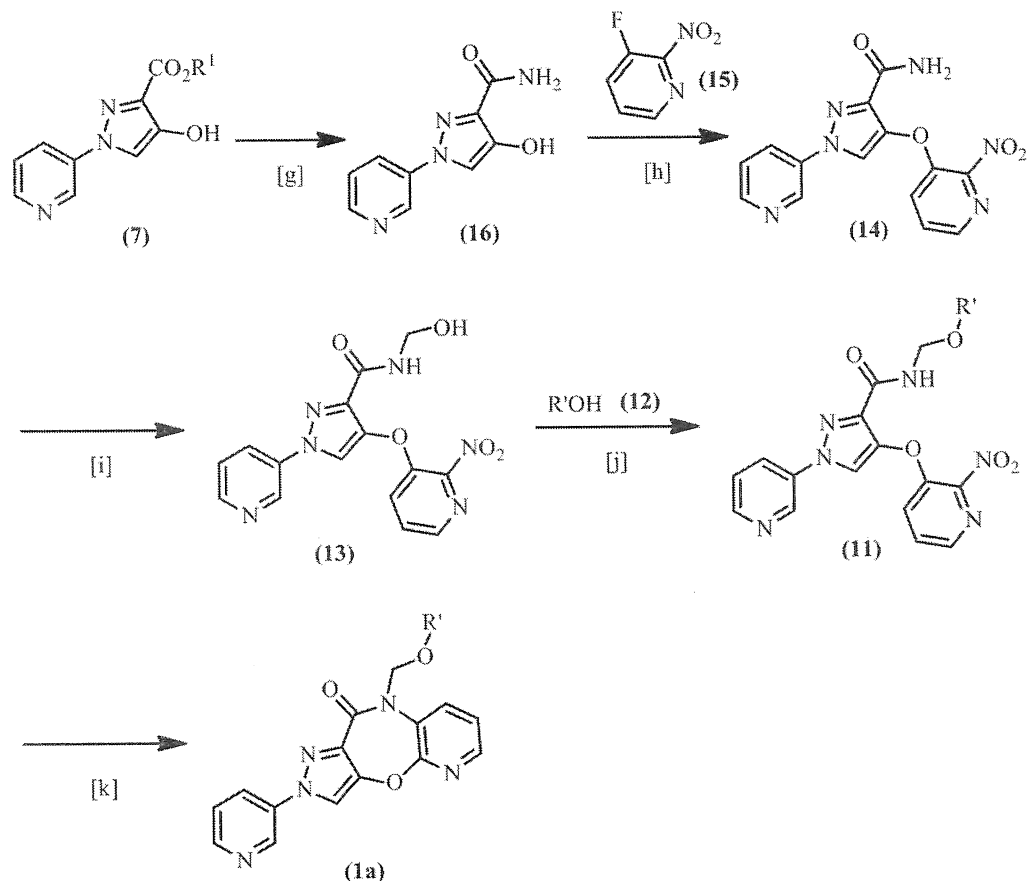
Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamit, N,N-dimetyl axetamit, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (3).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng mol, mỗi hợp chất chỉ cần được sử dụng với lượng mol cân bằng; tuy nhiên, hoặc hợp chất có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể thường được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông

thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất 2

công thức 3



{trong công thức này, R¹ là giống như được đề cập đến trên đây, và R' là nhóm (C₁-C₆) alkyl.}

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1a) được bao gồm trong Công thức chung (1) theo sáng chế có thể được sản xuất từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) sử dụng Bước [g], [h], [i], [j], và [k] dưới đây.

Bước [g] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16) bằng cách chuyển hóa nhóm este của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) thành nhóm amit.

Bước [h] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14) bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (15).

Bước [i] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13) bằng cách xử lý hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14) với focmalin.

Bước [j] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11) bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (12).

Bước [k] là bước sản xuất hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1a) được bao gồm trong Công thức chung (1) theo sáng chế, từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11) bằng phản ứng đóng vòng.

Phương pháp sản xuất của Bước [g]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16) có thể được sản xuất bằng cách xử lý hợp chất được thể hiện bằng Công thức (7) với amoniac có nước với sự có mặt của dung môi trơ.

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như N,N-dimetyl focmamit, N,N-dimetyl axetamit, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol hoặc các rượu khác; nước, v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau.

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [h]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16) phản ứng với hợp chất được thể hiện bằng Công thức (15) với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ liti diisopropylamit, liti hexametyldisilazan, natri hexametyldisilazan, hoặc các hợp chất cơ kim khác; natri butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; liti hydroxit, natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, hoặc các hydroxit khác; liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamit, N,N-dimetyl axetamit, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (16).

Vì phản ứng này là phản ứng cân bằng mol, mỗi hợp chất chỉ cần được sử dụng với lượng mol cân bằng; tuy nhiên, hoặc hợp chất có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể thường được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông

thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [i]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13) có thể được sản xuất bằng cách xử lý hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14) với 37% formalin với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat, kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v.. Bazơ thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14).

Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, cyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; diethyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; ethyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimethyl formamid, N,N-dimethyl acetamid, dimethyl sulfoxit, 1,3-dimethyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 10 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (14).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân

tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v..., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [j]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11) có thể được sản xuất bằng cách cho hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13) phản ứng với rượu được thể hiện bằng Công thức (12) đóng vai trò là dung môi với sự có mặt của axit oxalic.

Axit oxalic được sử dụng trong phản ứng này có thể được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13) để độ pH của dung dịch phản ứng đạt được ở mức quanh 3.

Rượu được thể hiện bằng Công thức (12) trong phản ứng này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 10 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (13).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v..., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v..., để sản xuất chất mục tiêu.

Phương pháp sản xuất của Bước [k]

Hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1a) được bao gồm trong Công thức chung (1) theo sáng chế có thể được sản xuất từ hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11) bằng phản ứng đóng vòng liên quan đến cơ chế sắp xếp lại Smile với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Bazơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là, ví dụ, natri butoxit bậc hai, kali butoxit bậc hai, hoặc các alkoxit khác; v.v..., natri hydrua, kali hydrua, hoặc hydrua kim loại khác; liti hydroxit, natri hydroxit, kali hydroxit, canxi hydroxit, hoặc các hydroxit khác; liti cacbonat, liti hydro cacbonat, natri cacbonat, natri hydro cacbonat,

kali cacbonat, kali hydro cacbonat, canxi cacbonat, magie cacbonat, xesi cacbonat, hoặc các cacbonat khác; liti axetat, natri axetat, kali axetat, hoặc các axetat khác, v.v.. Bazo thường được sử dụng với lượng nằm trong khoảng từ 1,0 đến 10 lần mol so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11).

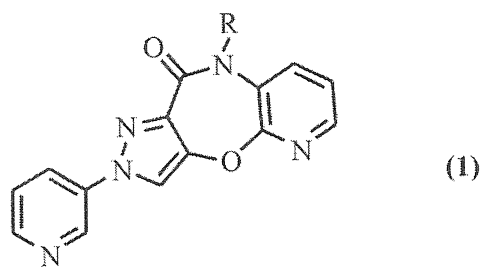
Dung môi trơ mà có thể được sử dụng trong phản ứng này có thể là bất kỳ dung môi nào miễn là nó không cản trở một cách đáng kể sự tiến triển của phản ứng này, như pentan, hexan, xyclohexan, hoặc hydrocacbon bão hòa mạch vòng hoặc mạch khác; benzen, toluen, xylen, hoặc các hydrocacbon thơm khác; dietyl ete, tetrahydrofuran (THF), dioxan, hoặc các ete mạch vòng hoặc mạch khác, axetonitril hoặc các nitril khác; etyl axetat hoặc các este khác; N,N-dimetyl focmamid, N,N-dimetyl axetamid, dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon hoặc các dung môi phân cực khác; v.v., mà bất kỳ trong số những dung môi trơ này có thể được sử dụng riêng hoặc hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được kết hợp với nhau. Dung môi trơ này có thể thường được sử dụng theo lượng bất kỳ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,1 đến 100 L so với 1 mol của hợp chất được thể hiện bằng Công thức (11).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng này thường cần được lựa chọn ở bất kỳ đâu nằm trong khoảng từ 0°C và điểm sôi của dung môi được sử dụng, và thời gian phản ứng, mà biến đổi phụ thuộc vào quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng, v.v., và không cố định, có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Ngay khi phản ứng hoàn thành, chất mục tiêu có thể được phân tách sử dụng bất kỳ phương pháp thông thường nào từ hệ thống phản ứng mà chứa chất mục tiêu, và nếu cần, chất được phân tách có thể được tinh chế bằng cách tái kết tinh, sắc ký cột, v.v., để sản xuất chất mục tiêu.

Phần tiếp theo minh họa ví dụ tiêu biểu của hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế, trong Bảng 1 dưới đây; tuy nhiên, nên được lưu ý rằng sáng chế không bị giới hạn ở những ví dụ này.

Trong bảng này, đặc tính vật lý thể hiện điểm sôi (°C), và vòng tròn đen trong “R” có nghĩa là vị trí gắn vào nguyên tử nitơ trong Công thức chung (1).

công thức 4



Bảng 1

Hợp chất	R	Đặc tính vật lý
1-1		209-210
1-2		182-183
1-3		-
1-4		-
1-5		-

Thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn chứa, làm thành phần hoạt tính của nó, hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế phù hợp cho việc kiểm soát nhiều côn trùng gây hại, như côn trùng gây hại trong nông nghiệp, côn trùng gây hại cho rừng, côn trùng gây hại cho hạt được bảo quản, côn trùng gây hại vệ sinh, giun tròn, v.v., mà phá hoại lúa, cây ăn trái, rau, và các cây trồng khác cũng như các loại hoa.

Ví dụ của côn trùng gây hại, giun tròn, v.v.. nêu trên bao gồm như sau:

Côn trùng gây hại thuộc loại bướm bao gồm, ví dụ Aoiraga (*Parasa consocia*), Akakiriba (*Anomis mesogona*), bướm phượng (*Papilio xuthus*), Azukisayamushiga (*Matsumuraeses azukivora*), Azukinomeiga (*Ostrinia scapulalis*), Spodoptera Châu Phi (*Spodoptera exempta*), sâu kéo màng mùa thu (*Hyphantria cunea*), sâu bore ngô Châu Âu (*Ostrinia furnacalis*), sâu keo (*Pseudaletia separata*), ngài vải thường (*Tinea translucens*), Igusashinmushiga (*Bactra furfurana*), bướm cánh thẳng bay nhanh (*Parnara guttata*), sâu cuốn lá lúa (*Marasmia exigua*), Inetsutomushi (*Parnara guttata*), sâu bore hồng (*Sesamia inferens*), Imokibaga (*Brachmia triannulella*), bướm sên (*Monema flavescens*), Irakusaginuwaba (*Trichoplusia ni*), Ukonnomeiga (*Pleuroptya ruralis*), Umeedashaku (*Cystidia couaggaria*), Uranamishijimi (*Lampides boeticus*),

bướm đêm đại bàng Pellucid (*Cephonodes hylas*), sâu đục chồi thuốc lá (*Helicoverpa armigera*), Ootobimonshachihoko (*Phalerodonta manleyi*), Oominoga (*Eumeta japonica*), bướm trắng lớn (*Pieris brassicae*), bướm đêm Lackey (*Malacosoma neustria testacea*), Kakinohetamushiga (*Stathmopoda masinissa*), Kakihosoga (*Cuphodes diospyrosella*), sâu cuốn lá táo (*Archips xylosteanus*), bướm đêm Turnip (*Agrotis segetum*), Kanshoshinkuihamaki (*Tetramoera schistaceana*), bướm phượng hoàng (*Papilio machaon hippocrates*), dơi chấm (*Endoclyta sinensis*), Ginmonhamoguriga (*Lyonetia prunifoliella*), Kinmonhosoga (*Phyllonorycter ringoneella*), Kurimiga (*Cydia kurokoi*), Kurimidorishinkuiga (*Eucoenogenes aestuosa*), bướm đêm nho (*Lobesia botrana*), Kuroshitaoiraga (*Latoia sinica*), Kurofutamonmadaramaiga (*Euzophera batangensis*), Kuwaihosohamaki (*Phalonidia mesotypa*), bướm đêm hổ dâu tằm (*Spilosoma imparilis*), Kuwanomeiga (*Glyphodes pyloalis*), Kuwahimehamaki (*Olethreutes mori*), bướm đêm vải thường (*Tineola bisselliella*), bướm đêm nhanh (*Endoclyta excrescens*), bướm đêm hạt Châu Âu (*Nemapogon granellus*), Kosukashiba (*Synanthedon hector*), bướm đêm Codling (*Cydia pomonella*), sâu tơ (*Plutella xylostella*), sâu cuốn lá lúa (*Cnaphalocrocis medinalis*), Sâu bore hồng phương Nam (*Sesamia calamistis*), bướm hai chấm (*Scirpophaga incertulas*), Shibatsutoga (*Pediasia teterrellus*), bướm đêm khoai tây (*Phthorimaea operculella*), bướm đêm tôm hùm (*Stauropus fagi persimilis*), Shiroichimonjimadaramaiga (*Etiella zinckenella*), sâu keo củ cải (*Spodoptera exigua*), dơi có mười chấm trắng (*Palpifer sexnotata*), Shironayotou (*Spodoptera mauritia*), bướm ống lúa không lò trắng (*Scirpophaga innotata*), Shiromonyaga (*Xestia c-nigrum*), Sujikiriyotou (*Spodoptera depravata*), bướm đêm Địa Trung Hải (*Ephestia kuehniella*), bướm đêm cam (*Angerona prunaria*), Seguroshachihoko (*Clostera anastomosis*), sâu đo đậu tương (*Pseudoplusia bao gồmns*), Daizusayamushiga (*Matsumuraeses falcana*), sâu đục chồi thuốc lá (*Helicoverpa assulta*), Tamanaginuwaba (*Autographa nigrisigna*), sâu ngài đêm đen (*Agrotis ipsilon*), sâu róm (*Euproctis pseudoconspersa*), bướm sâu cuốn lá chè nhỏ (*Adoxophyes orana*), sâu cuốn lá chè (*Caloptilia theivora*), bướm sâu cuốn lá chè (*Homona magnanima*), bướm đêm thuốc lá (*Ephestia elutella*), Chaminoga (*Eumeta minuscula*), Tsumaakashachihoko (*Clostera anachoreta*), *Heliothis maritima* (*Heliothis maritima*),

Tenguhamaki (*Sparganothis pilleriana*), Toumorokoshimeiga (*Busseola fusca*), Tussock (*Euproctis subflava*), Tobimonooedashaku (*Biston robustum*), sâu khoai tây (*Heliothis zea*), Nakajiroshtaba (*Aedia leucomelas*), Nashiiraga (*Narosoideus flavidorsalis*), Nashikenmon (*Viminia rumicis*), Nashichibiga (*Bucculatrix pyrivorella*), bướm đêm trái cây phương Đông (*Grapholita molesta*), Nashihosoga (*Spulerina astaurota*), Nashimadaramameiga (*Ectomyelois pyrivorella*), sâu bore ăn thân lúa (*Chilo suppressalis*), Negikoga (*Acrolepiopsis sapporensis*), bướm đêm Ấn Độ (*Plodia interpunctella*), Haimadaranomeiga (*Hellula undalis*), bướm đêm hạt Angoumois (*Sitotroga cerealella*), sâu ngài đêm phổ biến (*Spodoptera litura*), loại Tortricid (*Eucosma aporema*), Barahamaki (*Acleris comariana*), Himekuroiraga (*Scopelodes contractus*), Himeshiromondokuga (*Orgyia thyellina*), sâu keo mùa thu (*Spodoptera frugiperda*), Fukinomeiga (*Ostrinia zaguliaevi*), Futaobikoyaga (*Naranga aenescens*), Futatenkagibamodoki (*Andraca bipunctata*), bướm đêm nhỏ cánh trong (*Paranthrene regalis*), chim sẻ nhỏ (*Acosmeryx castanea*), sâu đục lá nhỏ (*Phyllocnistis toparcha*), bướm đêm trên nhỏ (*Endopiza viteana*), bướm đêm nhỏ cánh cứng (*Eupoecillia ambiguella*), sâu bướm đậu cánh nhung (*Anticarsia gemmatilis*), Hosobahaiirohamaki (*Cnephasia cinereipalpana*), bướm đêm sồi (*Lymantria dispar*), bướm đêm thông (*Dendrolimus spectabilis*), sâu bore quả đậu tương (*Leguminivora glycinivorella*), sâu bore quả legume (*Maruca testulalis*), Mamehimesayamushiga (*Matsumuraeses phaseoli*), Mamehosoga (*Caloptilia soyella*), sâu đục lá chanh (*Phyllocnistis citrella*), Maeusukinomeiga (*Omiodes indicata*), Midarekakumonhamaki (*Archips fuscocupreanus*), Mitsumonkinuwaba (*Acanthopplusia agnata*), Minoga (*Bambalina* sp.), bướm đêm quả đào (*Carposina niponensis*), Momonogomadaranomeiga (*Conogethes punctiferalis*), Momosukashiba (*Synanthedon* sp.), Momohamoguriga (*Lyonetia clerkella*), Monkiageha (*Papilio helenus*), bướm vàng nhạt phương Đông (*Colias erate poliographus*), Monkuroshachihoko (*Phalera flavescens*), Cabbage butterfly (*Pieris rapae crucivora*), bướm trắng như bướm bắp cải (*Pieris rapae*), bướm đuôi vàng (*Euproctis similis*), Yamanoimokoga (*Acrolepiopsis suzukiella*), sâu bore ngô Châu Âu (*Ostrinia nubilalis*), sâu keo bắp cải (*Mamestra brassicae*), Yomogiedashaku (*Ascotis selenaria*), Yomogioohosohamaki (*Phtheochroides clandestina*), Ringoohamaki

(*Hoshinoa adumbratana*), *Ringokareha* (*Odonestis pruni japonensis*), *Ringokenmon* (*Triaena intermedia*), *Ringokokakumonhamaki* (*Adoxophyes orana fasciata*), *Ringokoshinkui* (*Grapholita inopinata*), *Ringoshirohimehamaki* (*Spilonota ocellana*), *Ringohaiirohamaki* (*Spilonota lechriaspis*), *Ringohamakikuroba* (*Illiberis pruni*), *Ringohimeshinkui* (*Argyresthia conjugella*), *Ringohosoga* (*Caloptilia zachrysa*), *Ringomonhamaki* (*Archips breviplicanus*), *Wataakakiriba* (*Anomis flava*), sâu hồng (*Pectinophora gossypiella*), *Watanomeiga* (*Notarcha derogata*), *Wataherikuronomeiga* (*Diaphania indica*), sâu đục chồi thuốc lá (*Heliothis virescens*), *Wataringa* (*Earias cupreoviridis*), và sâu tương tự.

Côn trùng gây hại Hemiptera bao gồm, ví dụ bộ xít cỏ xanh da trời (*Nezara antennata*), bộ cây lúa miến (*Stenotus rubrovittatus*), bộ xít xọc đỏ (*Graphosoma rubrolineatum*), bộ lá lúa (*Trigonotylus caelestialium*), v.v., *Akahimeherikamemushi* (*Aeschynteles maculatus*), *Akahoshikasumikame* (*Creontiades pallidifer*), bộ xít chấm đỏ (*Dysdercus cingulatus*), *Akahoshimarukaigaramushi* (*Chrysomphalus ficus*), bộ vảy đỏ California (*Aonidiella aurantii*), ve sầu nâu lớn (*Graptopsaltria nigrofuscata*), bộ rệp (*Blissusleucopterus*), côn trùng vảy Iseriya (*Icerya purchasi*), bộ xít thân mảnh (*Piezodorus hybneri*), *Inekamemushi* (*Lagynotomus elongatus*), bộ nhảy lá lúa vàng (*Thaia subrufa*), bộ lúa đen (*Scotinophara lurida*), rệp gai (*Sitobion ibarae*), bộ xít Iwasaki (*Stariodes iwasakii*), *Usuiromarukaigaramushi* (rệp sáp dính), *Usumonmidorikasumikame* (*Taylorilygus pallidulus*), *Umekobuaburamushi* (*Myzasmumecola*), côn trùng vảy trắng ở cây mận (*Pseudaulacaspis prunicola*), rệp đậu Hà Lan (*Acyrtosiphon pisum*), *Okumoherikamemushi* (*Anacanthocoris striicornis*), *Okurotobikasumikame* (*Ectometopterus micantulus*), *Otogeshirahoshikamemushi* (*Eysarcoris lewisi*), *Oherikamemushi* (*Molipteryx fuliginosa*), *Ooyokobai* (*Cicadella viridis*), *Okabonoakaaburamushi* (*Rhopalosiphum rufiabdominalis*), *Oribukatakaigaramushi* (*Saissetia olea*), ruồi trắng nhà kính (*Trialeurodes vaporariorum*), *Kashihimeyokobai* (*Aguriahana quercus*), bộ xít Kasumi (*Lygus* spp.), *Kabawatafukimadaraaburamushi* (*Euceraphis punctipennis*), *Kankitsukaigaramushi* (*Andaspis kashicola*), *Kankitsukatakaigaramushi* (*Coccus pseudomagnoliarum*), rệp phương Đông (*Cavelerius saccharivorus*), *Kikugunbai* (*Galeatus spinifrons*),

Kikuhimehigenagaaburamushi (*Macrosiphoniella sanborni*), Kimarukaigaramushi (*Aonidiella citrina*), bọ xít hôi nâu (*Halyomorpha mista*), Kusugunbai (*Stephanitis fasciicarina*), Kusutogarikijirami (*Trioza camphorae*), rệp lúa (*Leptocorisa chinensis*), Kuritogarikijirami (*Trioza quercicola*), Kurumigunbai (*Uhlerites latius*), bọ nhảy lá nhỏ (*Erythroneura comes*), Kuroashihosonagakamemushi (*Paromius exiguus*), Kurokatamarukaigaramushi (*Duplaspidotus claviger*), Kurosujitsumaguroyokobai (*Nephotettix nigropictus*), Kurotobikasumikame (*Halticiellus insularis*), bọ nhảy lá mía (*Perkinsiella saccharicida*), Kuroringokijirami (*Psylla malivorella*), dầy nhảy dâu tằm (*Anomomeura mori*), sâu ăn bột Comstock (*Pseudococcus longispinis*), côn trùng vảy trắng dâu tằm (*Pseudaulacaspis pentagona*), côn trùng vảy trắng trên đào (*Pulvinaria kuwacola*), Koaokasumikame (*Apolygus lucorum*), Kobanehyotannagakamemushi (*Togo hemipterus*), Komikanaburamushi (*Toxoptera aurantii*), Satokibikonakaigaramushi (*Saccharicoccus sacchari*), Satokibinewatamushi (*Geoica lucifuga*), Satonousuirounka (*Numata muii*), Sanhozekaigaramushi (*Comstockaspis perniciosus*), côn trùng vảy tuyết trên chanh (*Unaspis citri*), rệp khoai tây (*Aulacorthum solani*), bọ xít Shirahoshi (*Eysarcoris ventralis*), ruồi trắng bạc lá (*Bemisia argentifolii*), Shiroooyokobai (*Cicadella spectra*), Shiromarukaigaramushi (*Aspidiotus hederæ*), Sukashihimeherikamemushi (*Liorhyssus hyalinus*), Segurohimekijirami (*Calophya nigradorsalis*), Sejirounka (*Sogatella furcifera*), rệp đậu tằm (*Megoura crassicauda*), rệp củ cải (*Brevicoryne brassicae*), rệp đậu tương (*Aphis glycines*), Taiwankumoharikamemushi (*Leptocorisa oratorius*), Taiwantsumaguroyokobai (*Nephotettix virescens*), Taiwanhigenagaaburamushi (*Uroeucon formosanum*), Tabakokasumikame (*Cyrtopeltis tennuis*), ruồi trắng (*Bemisia tabaci*), Chanokatakaigaramushi (*Lecanium persicae*), Chanokurohoshikaigaramushi (*Parlatoria theae*), Chanomarukaigaramushi (*Pseudaonidia paeoniae*), bọ nhảy lá trà xanh (*Empoasca onukii*), bọ hôi màu xanh cánh nâu (*Plautia stali*), Churippuneaburamushi (*Dysaphis tulipae*), rệp vùng khoai tây (*Macrosiphum euphorbiae*), rệp dây trên cây khô họ đỗ quyên (*Stephanitis pyrioides*), rệp vảy nến Ấn Độ (*Ceroplastes ceriferus*), Tsubakikurohoshikaigaramushi (*Parlatoria camelliae*), Tsumaguroaokasumikame (*Apolygus spinolai*), bọ nhảy lá lúa xanh (*Nephotettix cincticeps*), Tsuyaaokamemushi

(*Glaucias subpunctatus*), Tensaikasumikame (*Orthotylus flavosparsus*), rệp ngô (*Rhopalosiphum maidis*), bọ nhảy cây ngô (*Peregrinus maidis*), rệp xoắn chấm trắng (*Eysarcoris parvus*), rệp giường ngủ (*Cimex lectularius*), Todokijirami (*Psylla abieti*), bọ nhảy cây màu nâu (*Nilaparvata lugens*), Toberakijirami (*Psylla tobirae*), rệp bắp cải (*Eurydema rugosum*), rệp lê (*Schizaphis piricola*), Nashikijirami (*Psylla pyricola*), Nashikurohoshikaigaramushi (*Parlatoresopsis pyri*), Nashigunbai (*Stephanitis nashi*), Nashikonakaigaramushi (*Dysmicoccus wistariae*), Nashishironagakaigaramushi (*Lepholeucaspis japonica*), Nashimaruaburamushi (*Sappaphis piri*), rệp Turnip (*Lipaphis erysimi*), rệp hành xanh (*Neotoxoptera formosana*), Hasukubireaburamushi (*Rhopalosiphum nymphaeae*), bọ nhảy lá hoa hồng (*Edwardsianarosae*), Harannagakaigaramushi (*Pinnaspisaspidistae*), Hannokijirami (*Psylla alni*), Hannonagayokobai (*Speusotettix subfuscus*), Hannohimeyokobai (*Alnetoidia alneti*), bọ nhảy cây kê (*Sogatella panicicola*), Higenagakasumikame (*Adelphocoris lineolatus*), Himeakahoshikamemushi (*Dysdercus poecilus*), Himekurokaigaramushi (*Parlatoria ziziphi*), Himegunbai (*Uhrerites debile*), bọ nhảy cây màu nâu nhỏ (*Laodelphax striatellus*), Himenagame (*Eurydema pulchrum*), Himeharikamemushi (*Cletus trigonus*), Himefutatenagaawafuki (*Clovio punctata*), Himeyokobai (*Empoasca* sp.), Hiratakatakaigaramushi (*Coccus hesperidum*), Hiratahyotannagakamemushi (*Pachybrachius luridus*), sâu ăn bột Nhật Bản (*Planococcus kraunhiae*), rệp cây đuôi mèo (*Stenotus binotatus*), Futatenhimeyokobai (*Arboridia apicalis*), Futatenyokobai (*Macrosteles fascifrons*), rệp cây mận gai (*Dolycoris baccarum*), Buchihigekurokasumikame (*Adelphocoris triannulatus*), Phylloxera (*Viteus vitifolii*), bọ xít cây cheri (*Acanthocoris sordidus*), Hosokumoherikamemushi (*Leptocorisa acuta*), Hosokobanenagakamemushi (*Macropes obnubilis*), Hosoharikamemushi (*Cletus punctiger*), rệp đậu (*Riptortus clavatus*), Potetopishirido (*Paratrioza cockerelli*), Maekiawafuki (*Aphrophora costalis*), rệp mờ Nhật Bản (*Lygus disponi*), Madarakasumikame (*Lygus saundersi*), Matsukonakaigaramushi (*Crisicoccus pini*), bọ nhảy lá thông (*Empoasca abietis*), Matsumotokonakaigaramushi (*Crisicoccus matsumotoi*), rệp đậu (*Aphis craccivora*), rệp Plataspid (*Megacocta punctatissimum*), Marushirahoshikamemushi (*Eysarcoris guttiger*), côn trùng vảy tía (*Lepidosaphes*

beckii), dầy nhảy trên cây chanh Châu Á (*Diaphorina citri*), Mikankuroaburamushi (*Toxoptera citricidus*), Mikankonakaigaramushi (*Planococcus citri*), ruồi trắng trên cây chanh (*Dialeurodes citri*), ruồi trắng có nhiều gai trên cam (*Aleurocanthus spiniferus*), Mikanhimekonakaigaramushi (*Pseudococcus citriculus*), Mikanhimeyokobai (*Zyginella citri*), Mikanhimewatakaigaramushi (*Pulvinaria citricola*), Mikanhiratakaigaramushi (*Coccus discrepans*), Mikanmarukaigaramushi (*Pseudaonidia duplex*), Mikanwatakaigaramushi (*Pulvinaria aurantii*), rệp vỏ cây ăn trái Châu Âu (*Lecanium corni*), bọ xít xanh da trời phương Nam (*Nezara viridula*), rệp lá lúa mì (*Stenodema calcaratum*), rệp anh đào vàng yếm mạch (*Rhopalosiphum padi*), Mugihigenagaaburamushi (*Sitobion akebiae*), rệp xanh lúa mạch (*Schizaphis graminum*), Mugiyokobai (*Sorhoanus tritici*), rệp quần lá đào (*Brachycaudus helichrysi*), bọ xít tía (*Carpocoris purpureipennis*), rệp đào xanh (*Myzus persicae*), rệp mạn bột (*Hyalopterus pruni*), Yanagiaburamushi (*Aphis farinose yanagicola*), Yanagigunbai (*Metasalis populi*), rệp vảy đầu hình mũi tên (*Unaspis yanonensis*), Yamaasakijirami (*Mesohomotoma camphorae*), Yukiyanagiaburamushi (*Aphis spiraecola*), rệp táo (*Aphis pomi*), côn trùng vảy vỏ sò (*Lepidosaphes ulmi*), Ringokijirami (*Psylla mali*), Ringokurokasumikame (*Heterocordylus flavipes*), Ringokobuaburamushi (*Myzus malisuctus*), Ringoneaburamushi (*Aphidonuguis mali*), bọ nhảy lá táo (*Orientus ishidai*), rệp xanh táo (*Ovatus malicolens*), rệp táo có lông tơ (*Eriosoma lanigerum*), rệp vảy nền đỏ (*Ceroplastes rubens*), rệp bông (*Aphis gossypii*), và rệp tương tự.

Côn trùng gây hại thuộc bộ cánh cứng bao gồm, ví dụ Aosujikamikiri (*Xystrocera globosa*), Aobaarigatahanekakushi (*Paederus fuscipes*), Aohanamuguri (*Eucetonia roelofsi*), Adzuki bean một ngũ cốc (*Callosobruchus chinensis*), một ngũ cốc khoai lang (*Cylas formicarius*), một ngũ cốc cỏ đỉnh lăng (*Hypera postica*), một ngũ cốc trên cây lúa (*Echinocnemus squameus*), Inedorooimushi (*Oulema oryzae*), Inenekuihamushi (*Donacia provosti*), một ngũ cốc trên cây lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus*), bọ cánh cứng lá khoai lang (*Colasposoma dauricum*), một ngũ cốc khoai lang Tây Ấn (*Euscepes postfasciatus*), bọ cánh cứng đậu Mexico (*Epilachna varivestis*), một ngũ cốc đậu thông thường (*Acanthoscelides obtectus*), sâu ăn rễ ngô phương Tây (*Diabrotica virgifera virgifera*), Umechokkirizoumushi (*Involvulus cupreus*), bọ cánh cứng lá bầu bí

(*Aulacophora femoralis*), một ngũ cốc đậu Hà Lan (*Bruchus pisorum*), bộ rùa 28 chấm lớn (*Epilachna vigintioctomaculata*), bộ cánh cứng nhựa ngô (*Carpophilus dimidiatus*), bộ rùa (*Cassida nebulosa*), *Kiashinomihamushi* (*Luperomorpha tenebrosa*), bộ chết sọc (*Phyllotreta striolata*), bộ cánh cứng có sừng dài chấm vàng (*Psacotha hilaris*), *Kimadarakamikiri* (*Aeolesthes chrysothrix*), một ngũ cốc cây hạt dẻ (*Curculio sikkimensis*), bộ cánh cứng quả khô (*Carpophilus hemipterus*), bộ da hoa chanh (*Oxycetonia jucunda*), sâu ăn rễ ngô (*Diabrotica* spp.), bộ cánh cứng vàng (*Mimela splendens*), một ngũ cốc ngô (*Sitophilus zeamais*), bộ cánh cứng bột mỳ đỏ (*Tribolium castaneum*), một ngũ cốc gạo (*Sitophilus oryzae*), *Kohimekokunusutomodoki* (*Palorus subdepressus*), *Melolonthid* (*Melolontha japonica*), *Gomadarakamikiri* (*Anoplophora malasiaca*), sâu bột (*Neatus picipes*), bộ cánh cứng khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), sâu ăn rễ ngô phương Nam (*Diabrotica undecimpunctata howardi*), *Hunting billbug* (*Sphenophorus venatus*), *Jyushihoshikubinagahamushi* (*Crioceris quatuordecimpunctata*), một ngũ cốc mận (*Conotrachelus nenuphar*), *Daikonsaruzoumushi* (*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*), bộ cánh cứng lá củ cải (*Phaedon brassicae*), bộ cánh cứng thuốc lá (*Lasioderma serricorne*), *Chibikofukizoumushi* (*Sitona japonicus*), *Chairokogane* (*Adoretus tenuimaculatus*), sâu bột vàng (*Tenebrio molitor*), *Chairosaruhamushi* (*Basilepta balyi*), một ngũ cốc lá cây cỏ ba lá (*Hypera nigrirostris*), *Tensaitobihamushi* (*Chaetocnema concinna*), bộ da đồng (*Anomala cuprea*), *Nagachakogane* (*Heptophylla picea*), bộ cánh cứng *Nijuuyahoshi* (*Epilachna vigintioctopunctata*), sâu ăn rễ ngô phương Bắc (*Diabrotica longicornis*), bộ cánh cứng hoa (*Eucetonia pilifera*), sâu dây (*Agriotes* spp.), bộ cánh cứng thảm đen (*Attagenus unicolor japonicus*), bộ cánh cứng lá đậu (*Pagria signata*), *Rufocuprea* (*Anomala rufocuprea*), *Himekokunusutomodoki* (*Palorus ratzeburgii*), bộ cánh cứng nấm đen (*Alphitobius laevigatus*), bộ cánh cứng thảm *Himemaru* (*Anthrenus verbasci*), *Hiratakikuimushi* (*Lyctus brunneus*), một thóc tấp (*Tribolium confusum*), *Futasujihimehamushi* (*Medythia nigrobilineata*), *Budoutorakamikiri* (*Xylotrechus pyrrhoderus*), bộ cánh cứng hại khoai tây (*Epitrix cucumeris*), bộ cánh cứng vỏ thông (*Tomicus piniperda*), một cửa thông Nhật Bản (*Monochamus alternatus*), bộ cánh cứng Nhật Bản (*Popillia japonica*), bộ cánh cứng hổ trên đậu (*Epicauta gorhami*), một ngũ

cóc ngô (*Sitophilus zeamais*), *Momochokkirizomushi* (*Rhynchites heros*), một ngũ cốc trên rau (*Listroderes costirostris*), một ngũ cốc trên cây đậu đũa (*Callosobruchus maculatus*), *Ringokofukizomushi* (*Phyllobius armatus*), *Ringohanazomushi* (*Anthonomus pomorum*), *Rurihamushi* (*Linaeidea aenea*), một ngũ cốc trên quả nang (*Anthonomus grandis*), và một ngũ cốc tương tự.

Côn trùng gây hại bộ hai cánh bao gồm, ví dụ muỗi nhà thông thường (*Culex pipiens pallens*), ruồi củ cải (*Pegomya hyoscyami*), sâu đục lá Nam Mỹ (*Liriomyza huidobrensis*), ruồi nhà (*Musca domestica*), *Inekimoguribae* (*Clorops oryzae*), *Inekukimigiwabae* (*Hydrellia sasakii*), sâu đục lá lúa (*Agromyza oryzae*), sâu đục lá *Inehime* (*Hydrellia griseola*), sâu đục lá *Inehime* (*Hydrellia griseola*), *Ingenmoguribae* (*Ophiomyia phaseoli*), ruồi dưa hấu (*Dacus cucurbitae*), ruồi giấm cánh chấm (*Drosophila suzukii*), ruồi quả cheri Nhật Bản (*Rhacochlaena japonica*), ruồi chuồng chại (*Muscina stabulans*), *Nomibae* như *Okimonnomibae* (*Megaselia spiracularis*), *Oochobae* (*Clogmia albipunctata*), *Kiriujigagambo* (*Tipula aino*), *Kurokinbae* (*Phormia regina*), *Kogataakaieka* (*Culex tritaeniorhynchus*), muỗi anofen Trung Quốc (*Anopheles sinensis*), *Daikonbae* (*Hylemya brassicae* ruồi nhuế vỏ đậu tương (*Asphondylia* sp.), ruồi hạt ngô (*Delia platura*), giò hành (*Delia antiqua*), ruồi quả cheri Châu Âu (*Rhagoletis cerasi*), muỗi nhà tự sinh (*Culex pipiens molestus* Forskal), ruồi quả Địa Trung Hải (*Ceratitis capitata*), *Chibikurobanekinokobae* (*Bradysia agrestis*), *Tensaimogurihanabae* (*Pegomya cunicularia*), sâu đục lá khoai tây (*Liriomyza sativae*), sâu đục lá cà (*Liriomyza bryoniae*), *Namoguribae* (*Chromatomyia horticola*), sâu đục lá hành xanh (*Liriomyza chinensis*), muỗi nhà nhiệt đới (*Culex quinquefasciatus*), muỗi gây sốt vàng (*Aedes aegypti*), muỗi hổ (*Aedes albopictus*), Sâu đục lá đậu (*Liriomyza trifolii*), sâu đục lá khoai tây (*Liriomyza sativae*), ruồi quả phương Đông (*Dacus dorsalis*), ruồi cam Nhật Bản (*Dacus tsuneonis*), ruồi nhuế mụn cây đỏ lúa mì (*Sitodiplosis mosellana*), giò thân cây lúa mì (*Meromuza nigriventris*), ruồi quả Mê-xi-cô (*Anastrepha ludens*), ruồi giò táo (*Rhagoletis pomonella*), và ruồi tương tự.

Côn trùng gây hại cánh màng bao gồm, ví dụ *Amimeari* (*Pristomyrmex pungens*), *Betylidae* như kiến đen nhỏ (*Monomorium pharaonis*), *Oozuari* (*Pheidole noda*), ong cắn lá cây củ cải Thụy Điển (*Athalia rosae*), ong bắp cày mụn cây hạt dẻ (*Dryocosmus*

kuriphilus), kiến đen (*Formica fusca japonica*), ong Vespid, ong cần lá cây củ cải Thụy Điển lưng đen (*Athalia infumata infumata*), ong cần lá Churenji (*Arge pagana*), ong cần lá cải Nhật Bản (*Athalia japonica*), kiến cắt lá (*Acromyrmex* spp.), kiến lửa (*Solenopsis* spp.), Ringohabachi (*Arge mali*), Ruriari (*Ochetellus glaber*), và kiến tương tự.

Côn trùng gây hại bộ cánh thẳng bao gồm, ví dụ *Ruspolia lineosa* (*Homorocoryphus lineosus*), dế chũi (*Gryllotalpa* sp.), Koinago (*Oxya hyla intricata*), bộ nhảy lúa (*Oxya yezoensis*), châu chấu di cư (*Locusta migratoria*), bộ nhảy có Nhật Bản (*Oxya japonica*), Himekusakiri (*Homorocoryphus jezoensis*), dế đồng Emma (*Teleogryllus emma*), và dế tương tự.

Côn trùng gây hại bộ cánh viền bao gồm, ví dụ bộ trĩ Akaobi (*Selenothrips rubrocinctus*), bộ trĩ lúa (*Stenchaetothrips biformis*), bộ trĩ Inekuda (*Haplothrips aculeatus*), bộ trĩ Kakikuda (*Ponticulothrips diospyrosi*), bộ trĩ Kiirohana (*Thrips flavus*), bộ trĩ Kusakihiro (*Anaphothrips obscurus*), bộ trĩ Kusakuda (*Liothrips floridensis*), bộ trĩ Gladiolus (*Thrips simplex*), bộ trĩ Kurogehana (*Thrips nigropilosus*), bộ trĩ Croton (*Heliothrips haemorrhoidalis*), bộ trĩ dâu tằm (*Pseudodendrothrips mori*), bộ trĩ Cosmos (*Microcephalothrips abdominalis*), bộ trĩ Shiionagakuda (*Leeuwenia pasanii*), bộ trĩ Shiimarukuda (*Litotetothrips pasaniae*), bộ trĩ chanh (*Scirtothrips citri*), bộ trĩ Sinakuda (*Haplothrips chinensis*), bộ trĩ Daizu (*Mycterothrips glycines*), bộ trĩ Daizusuiro (*Thrips setosus*), bộ trĩ Chanokihiro (*Scirtothrips dorsalis*), bộ trĩ Chanokuro (*Dendrothrips minowai*), bộ trĩ Tsumekusakuda (*Haplothrips niger*), bộ trĩ Negi (*Thrips tabaci*), bộ trĩ Negikuro (*Thrips alliorum*), bộ trĩ Hana (*Thrips hawaiiensis*), bộ trĩ Hana Kuda (*Haplothrips kurdjumovi*), bộ trĩ Higebuto (*Chirothrips manicatus*), bộ trĩ hoa (*Frankliniella intonsa*), bộ trĩ Loquat Hana (*Thrips coloratus*), bộ trĩ hoa phương Tây (*Frankliniella occidentalis*), bộ trĩ Minamikihiro (*Thrips palmi*), bộ trĩ Yurikihiro (*Frankliniella lilivora*), bộ trĩ Yurinokuda (*Liothrips vaneeckei*), và bộ trĩ tương tự.

Côn trùng gây hại bộ ve bét bao gồm, ví dụ bộ chết chigger xanh (*Leptotrombidium akamushi*), Ashinowahadani (*Tetranychus ludeni*), ve bét cây chít chít Mỹ (*Dermacentor variabilis*), bét nhện Ishiinami (*Tetranychus truncatus*), bét bụi nhà (*Ornithonyssus bacoti*), bét Demodex (*Demodex canis*), bét nhện cheri (*Tetranychus viennensis*), bét nhện Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ve bét như ve bét chó nâu

(*Rhipicephalus sanguineus*), *Stag tsumedani* (*Cheyletus malaccensis*), *Tyrophagus dimidiatus* (*Tyrophagus putrescentiae*), bét bụi nhà Mỹ (*Dermatophagoides farinae*), nhện lưng đỏ (*Latrodectus hasseltii*), ve bét Taiwankaku (*Dermacentor taiwanicus*), bét Chanonagasabi (*Acaphylla theavagrans*), bét lớn (*Polyphagotarsonemus latus*), bét nâu đỏ nhạt khoai tây (*Aculops lycopersici*), bét gia cầm phương Bắc (*Ornithonyssus sylvairum*), bét nhện 2 chấm (*Tetranychus urticae*), bét Nisenashisabi (*Eriophyes chibaensis*), bét Scabies (*Sarcoptes scabiei*), Futatogechimadani (*Haemaphysalis longicornis*), ve bét chân đen (*Ixodes scapularis*), *Tyrophagus dimidiatus* (*Tyrophagus similis*), Hosotsumedani (*Cheyletus eruditus*), bét đỏ trên chanh (*Panonychus citri*), Minami tsumedani (*Cheyletus moorei*), bét nhện Minami (*Brevipalpus phoenicis*), bét Mimihizen (*Octodectes cynotis*), bét bụi nhà Châu Âu (*Dermatophagoides pteromyssus*), Yamatochimadani (*Haemaphysalis flava*), *Ixodes ovatus* (*Ixodes ovatus*), bét rỉ sắt cây quýt Ryukyu (*Phyllocoptura citri*), bét rỉ sắt táo (*Aculus schlechtendali*), bét đỏ Châu Âu (*Panonychus ulmi*), ve bét sao đơn (*Amblyomma americanum*), và bét gà (*Dermanyssus gallinae*), Robinnedani (*Rhyzoglyphus robini*), loại Nedanimodoki (*Sancassania* sp.), và loại tương tự.

Côn trùng gây hại họ mối bao gồm, ví dụ mối Amami (*Reticulitermes miyatakei*), mối gỗ khô Mỹ (*Incisitermes minor*), mối đất Formosan (*Coptotermes formosanus*), mối khổng lồ (*Hodotermopsis japonica*), mối Kanmon (*Reticulitermes* sp.), Kiashishiroari (*Reticulitermes flaviceps amamianus*), mối Kushimoto (*Glyptotermes kushimensis*), mối đất Koushu formosan (*Coptotermes guangzhouensis*), mối Koushun (*Neotermes koshunensis*), mối Kodama (*Glyptotermes kodamai*), mối Satsuma (*Glyptotermes satsumensis*), mối Daikoku (*Cryptotermes domesticus*), mối Đài Loan (*Odontotermes formosanus*), mối Nakajima (*Glyptotermes nakajimai*), mối Nitobe (*Pericapritermes nitobei*), mối Yamato (*Reticulitermes speratus*), và mối tương tự.

Côn trùng gây hại thuộc bộ gián và mối bao gồm, ví dụ gián Smokybrown (*Periplaneta fuliginosa*), gián Đức (*Blattella germanica*), gián phương Đông (*Blatta orientalis*), gián nâu (*Periplaneta brunnea*), gián Đức Hime (*Blattella lituricollis*), gián Nhật Bản (*Periplaneta japonica*), gián Mỹ (*Periplaneta americana*), và gián tương tự.

Bọ chét bao gồm, ví dụ bọ chét ở người (*Pulex irritans*), bọ chét ở mèo (*Ctenocephalides felis*), bọ chét ở gà (*Ceratophyllus gallinae*), và bọ chét tương tự.

Giun tròn bao gồm, ví dụ giun tròn dâu tây (*Nothotylenchus acris*), giun tròn Ineshingare (*Aphelenchoides besseyi*), giun tròn đồng cỏ phương Bắc (*Pratylenchus penetrans*), giun tròn mắt rể phương Bắc (*Meloidogyne hapla*), giun tròn mắt rể khoai lang (*Meloidogyne incognita*), giun tròn nang khoai tây (*Globodera rostochiensis*), giun tròn mắt rể Java (*Meloidogyne javanica*), giun tròn nang đậu tương (*Heterodera glycines*), giun tròn đồng cỏ phương Nam (*Pratylenchus coffeae*), giun tròn đồng cỏ lúa mì (*Pratylenchus neglectus*), giun tròn rể cam quan thoại (*Tylenchus semipenetrans*), và giun tròn tương tự.

Động vật thân mềm bao gồm, ví dụ sên táo (*Pomacea canaliculata*), sên Châu Phi khổng lồ (*Achatina fulica*), sên (*Meghimatium bilineatum*), sên Chaco (*Lehmannina valentiana*), Kouranamekuji (*Limax flavus*), sên cầu Siebold (*Acusta despecta sieboldiana*), và sên tương tự.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có hiệu quả trừ sâu mạnh trên các côn trùng gây hại khác như sâu ăn lá khoai tây (*Tuta absoluta*).

Ngoài ra, bét động vật sinh học, mà cũng có thể được kiểm soát, bao gồm, ví dụ bét như *Rhipicephalus microplus* (*Boophilus microplus*), ve bét chó nâu (*Rhipicephalus sanguineus*), Futatogechimadani (*Haemaphysalis longicornis*), Kichimadani (*Haemaphysalis flava*), Adenophora chimadani (*Haemaphysalis campanulata*), Isukachimadani (*Haemaphysalis concinna*), Yamatochimadani (*Haemaphysalis japonica*), Higenagachimadani (*Haemaphysalis kitaokai*), ve bét Iyasuchi (*Haemaphysalis ias*), Ixodes ovatus (*Ixodes ovatus*), ve bét Tanegata (*Ixodes nipponensis*), bét Schulze (*Ixodes persulcatus*), bét Takasago Kirara (*Amblyomma testudinarium*), Ootogechimadani (*Haemaphysalis megaspinosa*), bét Aminokaku (*Dermacentor reticulatus*), và bét Taiwankaku (*Dermacentor taiwanensis*), Torisashidani như bét ở gà (*Dermanyssus gallinae*), bét gia cầm phương bắc (*Ornithonyssus sylviarum*), và bét gia cầm nhiệt đới (*Ornithonyssus bursa*), bọ chét chig-ger như bọ chét chig-ger Nanyo (*Eutrombicula wichianni*), chét gây sốt Scrub (*Leptotrombidium*

akamushi), bọ chét chig-ger không sừng (*Leptotrombidium pallidum*), bọ chét chig-ger Fuji (*Leptotrombidium fuji*), bọ chét chig-ger Tosa (*Leptotrombidium tosa*), chét Aki Châu Âu (*Neotrombicula autumnalis*), bọ chét chig-ger Mỹ (*Eutrombicula alfreddugesi*), và bọ chét chig-ger Miyagawa Tama (*Helenicula miyagawai*), Tsumedani như *Inutsumedani* (*Cheyletiella yasguri*), tsumedani ở thỏ (*Cheyletiella parasitivorax*), và *Nekotsumedani* (*Cheyletiella blakei*), *Sarcoptes* như chét ở thỏ (*Psoroptes cuniculi*), *Ushishokuhidani* (*Chorioptes bovis*), chét tai chó (*Octodectes cynotis*), chét Scabies (*Sarcoptes scabiei*), và chét foraminous ở mèo (*Notoedres cati*), *Demodex* như loại chét *Demodex* (*Demodex canis*), và chét tương tự.

Bọ chét, mà cũng có thể được kiểm soát, bao gồm, ví dụ côn trùng không cánh ký sinh ngoài trong loài bọ chét, hoặc cụ thể là, bọ chét thuộc họ Pulicidae và họ Ceratophyllus, trong số các họ khác. Bọ chét thuộc họ Pulicidae bao gồm, ví dụ bọ chét ở chó (*Ctenocephalides canis*), bọ chét ở mèo (*Ctenocephalides felis*), bọ chét ở người (*Pulex irritans*), bọ chét ở gà (*Echidnophaga gallinacea*), bọ chét ở chuột Cheops (*Xenopsylla cheopis*), bọ chét ở chuột (*Leptopsylla segnis*), bọ chét ở chuột Châu Âu (*Nosopsyllus fasciatus*), bọ chét ở chuột Yamato (*Monopsyllus anisus*), và bọ chét tương tự.

Hơn nữa, các ký sinh trùng bên ngoài khác mà có thể được kiểm soát bao gồm, ví dụ rận như rận gia súc mũi ngắn (*Haematopinus eurysternus*), Umajirami (*Haematopinus asini*), Hitsujijirami (*Dalmalinia ovis*), Ushihosojirami (*Linognathus vituli*), rận ở lợn (*Haematopinus suis*), rận công cộng (*Phthirus pubis*), và rận ở đầu (*Pediculus capitis*), rận trên cơ thể như Inuhajirami (*Trichodectes canis*), và côn trùng bộ hai cánh hút máu khác, như con mòng (*Tabanus trigonus*), Uainukaka (*Culicoides schultzei*), Tsumetogebuyu (*Simulium ornatum*), và côn trùng tương tự. Ngoài ra, ký sinh trùng bên trong bao gồm, ví dụ giun phổi, giun tóc, giun hạch, ký sinh trùng dạ dày, giun tròn, côn trùng dạng chỉ và các loại giun tròn khác, *Diphyllbothrium mansonii*, *Diphyllbothrium latum*, *Diphyllbothrium caninum*, *Taenia multiceps*, *Echinococcus granulosus*, và *Echinococcus multilocularis* và các loại sán dây khác, *Schistosomiasis japonica*, *Fasciola hepatica* và các loại sán lá khác, trùng cầu, ký sinh trùng gây sốt rét,

chounainikuhoushichu, *Toxoplasma gondii*, *Cryptosporidium* và động vật nguyên sinh khác, v.v..

Vì thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn mà chứa, làm thành phần hoạt tính của nó, hợp chất oxazepin hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế đóng vai trò hiệu quả đáng kể kiểm soát côn trùng gây hại nêu trên đây mà phá hoại vụ mùa lúa, vụ mùa trên cánh đồng, cây ăn trái, rau, và các cây trồng khác cũng như các loại hoa, nó có thể được áp dụng trong hoặc trên vườn ươm, cánh đồng lúa, cánh đồng vụ mùa, cây ăn trái, rau, và các cây trồng khác, các loại hoa, v.v., và hạt của chúng, nước trong cánh đồng lúa, thân và lá, đất và các chất mang trồng trọt khác, v.v., khi côn trùng gây hại dự kiến được sinh ra, trước khi côn trùng gây hại sinh ra, hoặc khi sự sinh ra của chúng được xác nhận, và thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế sẽ đạt được hiệu quả nhất định. Đặc biệt là, chế độ ưu tiên sử dụng là chế độ mà sử dụng cái được gọi là đặc tính di trú xâm nhập, mà liên quan đến áp dụng cho đất tại vườn ươm cho mùa màng, các loại hoa, v.v., đất quanh lỗ trồng cây được sử dụng để cấy ghép cây trồng, rễ cây trồng, nước tưới, nước được sử dụng cho trồng cây thủy canh, v.v., để hợp chất được đề xuất theo sáng chế sẽ được hấp thụ vào đất, hoặc từ rễ cây mà không đi qua đất.

Cây trồng có ích mà thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có thể được sử dụng trên đó không bị giới hạn theo bất kỳ cách nào, và ví dụ bao gồm hạt (như, lúa, lúa mạch, lúa mì, lúa mạch đen, yến mạch, ngô, v.v.), đậu (đậu tương, đậu azuki, đậu răng ngựa, đậu Hà Lan, đậu bầu dục, lạc, v.v.), cây ăn trái/hoa quả (táo, chanh, lê, nho, đào, mận, đào vàng, óc chó, hạt dẻ, hạnh nhân, chuối, v.v.), rau/quả rậm lá (bắp cải, khoai tây, rau bina, xúp lơ, rau diếp, hành, hành xanh (ớt, lạc tiên), ớt chuông, cà, dâu tây, hạt tiêu, đậu bắp, tỏi tây v.v.), rau củ (cà rốt, khoai tây, khoai lang, khoai môn, củ cải dai, củ cải Thụy Điển, củ sen, nguru bàng, tỏi, họ tây, v.v.), cây trồng để chế biến (bông, cói, củ cải, hoa bia, mía, củ cải đường, ô lưu, gôm, cà phê, thuốc lá, trà, v.v.), cây họ bầu bí (bí ngô, dưa chuột, dưa hấu, dưa phương Đông, dưa, v.v.), cỏ dùng cho chăn nuôi (cỏ vườn, lúa miến, cỏ đuôi mèo, cỏ ba lá, cỏ linh lăng, v.v.), cỏ (cỏ Hàn Quốc, cỏ cuốn, v.v.), thảo mộc và các loại cây trồng khác (oải hương, hương thảo, cỏ xạ hương, rau mùi tây, tiêu, gừng, v.v.), các loại hoa (hoa cúc, hoa hồng,

hoa cẩm chướng, hoa lan, hoa tu líp, hoa loa kèn, v.v.), cây trồng trong vườn (bạch quả, cheri, nguyệt quế Nhật Bản, v.v.), cây trồng trong rừng (linh sam, vân sam Nhật Bản, thông, liễu sam, tuyết tùng, cây gỗ hinoki, bạch đàn, v.v.) và các cây khác.

"Cây trồng" nêu trên đây bao gồm cây trồng chịu được chất ức chế isoxaflutol và các chất ức chế HPPD khác, imazethapyr, thifensulfuron methyl, và các chất ức chế ALS khác, glyphosat và các chất ức chế enzyme tổng hợp EPSP khác, glufosinat và các chất ức chế enzyme tổng hợp glutamin khác, setoxydim và các chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, và bromoxynil, dicamba, 2,4-D, và thuốc diệt cỏ khác, đã được đề xuất bởi phương pháp nuôi trồng hoặc kỹ thuật biến đổi gen truyền thống.

Ví dụ của "cây trồng" có khả năng kháng thuốc đã được đề xuất bởi phương pháp nuôi trồng truyền thống bao gồm hạt cải dầu, lúa mì, hướng dương, và lúa kháng lại imazethapyr và các thuốc diệt cỏ loại ALS ức chế imidazolinon khác, như những loại đang được bán dưới tên Clearfield (nhãn hiệu đã đăng ký). Ngoài ra, đậu tương đã được tạo ra kháng lại thifensulfuron methyl và các thuốc diệt cỏ loại ALS ức chế sulfonyl urê sử dụng phương pháp nhân giống truyền thống đã có mặt trên thị trường dưới tên sản phẩm đậu tương STS. Tương tự, ngô SR là một ví dụ của cây trồng chịu được chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, như trion oxim, allyloxy phenoxy propionat và thuốc diệt cỏ khác, đã được bổ sung sử dụng phương pháp nhân giống truyền thống.

Ngoài ra, cây trồng chịu được chất ức chế axetyl CoA carboxylaza đã được bổ sung được mô tả trong tài liệu Proceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America (Proc. Natl. Acad. Sci. USA), quyển 87, trang 7175-7179 (1990), v.v.. Ngoài ra, axetyl CoA carboxylaza biến đổi kháng lại chất ức chế axetyl CoA carboxylaza được báo cáo trong tài liệu Weed Science, quyển 53, trang 728-746 (2005), v.v.. và bằng cách đưa những gen axetyl CoA carboxylaza đột biến này vào cây trồng thông qua kỹ thuật biến đổi gen, hoặc bằng cách đưa sự đột biến liên quan đến sự bổ sung khả năng chống chịu của cây trồng đối với axetyl CoA carboxylaza, cây trồng kháng lại chất ức chế axetyl CoA carboxylaza có thể được tạo ra; và hơn nữa, bằng cách đưa sự biến đổi thay thế axit amino đặc trưng vào gen axetyl CoA carboxylaza của cây trồng, gen ALS, v.v., mà được thực hiện bằng cách đưa vào tế bào cây trồng axit nucleic mà sự biến đổi thay thế bazơ được đưa vào sử dụng sự gắn kết khảm (Gura T. 1999.

Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318), cây trồng kháng lại chất ức chế axetyl CoA carboxylaza, chất ức chế ALS, v.v., có thể được tạo ra, và thuốc trừ sâu nông nghiệp/ngành làm vườn được đề xuất theo sáng chế cũng có thể được sử dụng trên những cây trồng này.

Hơn nữa, độc tố mà biểu hiện trong cây trồng biến đổi gen bao gồm, protein trừ sâu thu được từ *Bacillus cereus* và *Bacillus popilliae*; Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C và các nội độc tố khác, VIP1, VIP2, VIP3 hoặc VIP3A và các protein trừ sâu khác thu được từ *Bacillus thuringiensis*; protein trừ sâu thu được từ giun tròn; độc tố bọt cạp, độc tố nhện, độc tố ong, hoặc độc tố thân kinh đặc trưng của côn trùng và các độc tố khác sản sinh trong động vật; độc tố dạng sợi mảnh; lectin cây trồng; agglutinin; chất ức chế trypsin, chất ức chế serin proteaza, patatin, xystatin, chất ức chế papain và các chất ức chế proteaza khác; rixin, ngô-RIP, abrin, luffin, saporin, bryodin và các protein bất hoạt ribosom khác (RIP); 3-hydroxysteroid oxidaza, ecdysteroid-UDP-glucosyl transferaza, cholesterol oxidaza và các enzym trao đổi chất steroid khác; chất ức chế ecdyson; HMG-CoA reductaza; chất ức chế kênh natri và kênh canxi và các chất ức chế kênh ion khác; esteraza hormone trẻ; thụ thể hormone lợi tiểu; stilben syntaza; bi-benzyl syntaza; chitinaza; glucanaza, v.v..

Ngoài ra, độc tố mà biểu hiện trong những cây trồng biến đổi gen này bao gồm độc tố hỗn hợp trên cơ sở của Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab, Cry35Ab và protein nội độc tố khác, VIP1, VIP2, VIP3, VIP3A và các protein trừ sâu khác, cũng như độc tố một phần và độc tố điều chỉnh. Độc tố hỗn hợp được tạo ra bằng kỹ thuật điều chỉnh, trên cơ sở của sự kết hợp mới của miền khác nhau của những protein này. Trong số độc tố một phần, Cry1Ab mà chuỗi axit amino của nó khiếm khuyết một phần được biết đến. Độc tố điều chỉnh là độc tố tự nhiên mà axit amino hoặc axit của nó được thế.

Ví dụ của những độc tố này, và cây trồng được biến đổi có khả năng tổng hợp những độc tố này, được mô tả trong EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073, v.v..

Độc tố chứa trong những cây trồng biến đổi này làm tăng khả năng kháng cho cây trồng, đặc biệt là, đối với côn trùng bộ cánh cứng, côn trùng bộ cánh nửa, côn trùng

bộ hai cánh, côn trùng gây hại thuộc loại bướm và giun tròn. Thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có thể được kết hợp hoặc được hệ thống hóa với công nghệ này.

Để kiểm soát nhiều côn trùng gây hại, thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có thể được sử dụng trực tiếp, hoặc trong trạng thái được pha loãng hoặc được tạo huyền phù trong nước, v.v., một cách thích hợp, trên cây trồng nơi mà côn trùng gây hại và giun tròn dự kiến được sinh ra, với lượng hiệu quả trong việc kiểm soát côn trùng gây hại và giun tròn này; để kiểm soát côn trùng gây hại và giun tròn hình thành trên cây ăn trái, hạt, rau, v.v., ví dụ nó có thể được phun trên thân và, chế thành dạng dung dịch trong đó hạt giống được ngâm, được chuẩn bị ở dạng bột để phủ hoặc cách khác là xử lý hạt giống sử dụng Calper, v.v., được trộn vào toàn bộ các lớp đất, được áp dụng trong luống cây, được trộn vào đất nền, được áp dụng trong cây con, lỗ trồng cây, quanh rễ cây trồng, rắc lên trên, đưa vào thùng lúa, trên bề mặt nước, v.v., hoặc được áp dụng trong đất, v.v., để được hấp thụ qua rễ. Nó có thể cũng được áp dụng trong dung dịch chất dinh dưỡng trong canh tác (thủy canh) sử dụng dung dịch chất dinh dưỡng, hoặc được sử dụng bằng cách tạo khói, tiêm vào thân cây, v.v..

Hơn nữa, thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có thể được sử dụng trực tiếp, hoặc trong trạng thái được pha loãng hoặc được tạo huyền phù trong nước, v.v., một cách thích hợp, ở vị trí nơi mà côn trùng gây hại dự kiến được sinh ra, với lượng hiệu quả trong việc kiểm soát côn trùng gây hại này, ví dụ nó có thể được phun trên côn trùng gây hại cho hạt được bảo quản, bọ côn trùng gây hại, côn trùng gây hại vệ sinh, côn trùng gây hại cho rừng, v.v., và có thể cũng được áp dụng cho vật liệu xây dựng dân cư, được tạo khói, được sử dụng như chất môi, v.v..

Phương pháp xử lý hạt giống bao gồm, ví dụ phương pháp ngâm hạt giống trong sản phẩm ở dạng lỏng hoặc trong chất lỏng được chuẩn bị từ sản phẩm ở dạng rắn, với hoặc mà không pha loãng, và cho chất phản ứng thấm vào trong hạt giống; phương pháp trộn và phủ bột sản phẩm ở dạng rắn hoặc dạng lỏng với/trên hạt giống để làm cho chất phản ứng gắn vào bề mặt của hạt giống; phương pháp trộn chất phản ứng với nhựa, polyme, hoặc các chất mang kết dính khác và sau đó phủ hỗn hợp trên hạt giống; và phương pháp phun chất phản ứng gần hạt giống khi chúng được gieo.

"Hạt giống" được xử lý bằng những phương pháp này đề cập đến dạng ban đầu của cây trồng được canh tác để nhân giống cây trồng, mà ví dụ ngoài hạt giống, bao gồm, củ giống, củ, khoai tây giống, mầm thân, cây giống, củ giống có vảy, và các dạng cây trồng được sử dụng cho nhân giống sinh dưỡng nhằm mục đích ghép.

Khi áp dụng phương pháp theo sáng chế, "đất" hoặc "chất mang trồng trọt" cho cây trồng đề cập đến sự hỗ trợ để canh tác cây trồng, hoặc một cách cụ thể sự hỗ trợ trong đó để phát triển rễ, và vật liệu của nó, mà không bị giới hạn theo bất kỳ cách nào mà cây trồng có thể trồng trên đó, có thể gọi là đất, thảm vườn ươm, nước, v.v., hoặc một cách cụ thể nó có thể là, ví dụ cát, đá bột, chất khoáng bón cây, đất tảo cát, tảo, chất dạng gel, chất polymeic, len khoáng, len thủy tinh, dăm gỗ, vỏ cây, v.v..

Phương pháp phun trên thân và lá của cây trồng hoặc trên côn trùng gây hại cho hạt được bảo quản, côn trùng nhà, côn trùng gây hại vệ sinh, côn trùng gây hại cho rừng, v.v., bao gồm phương pháp phun sản phẩm ở dạng nhũ tương, dạng có thể chảy, hoặc các dạng lỏng khác, hoặc ở dạng bột có thể thấm ướt, dạng hạt có thể phân tán trong nước, hoặc các dạng rắn khác mà đã được pha loãng trong nước phù hợp; phương pháp phun sản phẩm ở dạng bột; dạng được tạo khối hoặc dạng tương tự.

Phương pháp áp dụng cho đất bao gồm, ví dụ phương pháp áp dụng sản phẩm ở dạng lỏng với hoặc mà không pha loãng trong nước, cho rễ cây của cây trồng, nền vườn ươm, v.v.; phương pháp phun sản phẩm ở dạng hạt trên rễ cây của cây trồng, nền vườn ươm, v.v.; phương pháp phun sản phẩm ở dạng bột, dạng bột có thể thấm ướt, dạng hạt có thể phân tán trong nước, dạng hạt, v.v., trước khi gieo hạt hoặc cấy ghép, và trộn nó với toàn bộ đất; và phương pháp phun sản phẩm ở dạng bột, dạng bột có thể thấm ướt, dạng hạt có thể phân tán trong nước, dạng hạt, v.v., vào lỗ trồng cây, luống cây, v.v., trước khi gieo hạt hoặc trước khi trồng cây, v.v..

Xem xét phương pháp áp dụng cho nền vườn ươm lúa, sản phẩm có thể ở dạng khác nhau phụ thuộc vào thời gian áp dụng, như trạng thái gieo hạt, trạng thái cây trồng, trạng thái cấy ghép, v.v., nơi mà nó có thể là được áp dụng ở những dạng này ở dạng bột, hạt có thể phân tán trong nước, hạt, v.v.. Sản phẩm có thể cũng được trộn với đất canh tác, ở dạng hỗn hợp của đất canh tác với bột, hạt có thể phân tán trong nước, hạt,

v.v.., như trộn với đất nền, trộn với đất lớp mặt, trộn với toàn bộ đất canh tác, v.v.. Đất canh tác có thể được tạo lớp một cách đơn giản với nhiều dạng của sản phẩm.

Ở phương pháp áp dụng cho cánh đồng lúa, sản phẩm ở dạng gói lớn, dạng gói, dạng hạt, dạng hạt có thể phân tán trong nước hoặc các dạng rắn khác, hoặc ở dạng có thể chảy, dạng nhũ tương, hoặc các dạng lỏng khác, thường được phun trên cánh đồng lúa mà ngập trong nước. Ngoài ra, khi gieo mạ ở dạng phù hợp có thể là trực tiếp, hoặc trước tiên được trộn với phân bón, được phun lên trên hoặc được phun vào đất. Ngoài ra, chất phản ứng ở dạng nhũ tương, dạng có thể chảy, v.v.., có thể được sử dụng tại cổng cấp nước, hệ thống tưới tiêu hoặc các nguồn khác của nước, v.v.., mà chảy vào cánh đồng lúa, để nó được áp dụng với nguồn cấp nước và nhân công được tiết kiệm.

Với vụ mùa trên cánh đồng, chất mang trồng trọt, v.v.., trong phạm vi gần của hạt giống và cây trồng có thể được xử lý ở giai đoạn gieo hạt qua giai đoạn vườn ươm. Với cây trồng mà hạt giống của nó được gieo trực tiếp trên cánh đồng, lý tưởng là sản phẩm trực tiếp được áp dụng cho hạt giống hoặc cho rễ cây trồng trong quá trình canh tác. Sản phẩm có thể được phun ở dạng hạt, hoặc sản phẩm ở dạng lỏng với hoặc mà không pha loãng trong nước có thể được áp dụng qua tưới tiêu, v.v.. Cũng có thể mong muốn trộn sản phẩm ở dạng hạt với chất mang trồng trọt trước khi gieo hạt, và sau đó thực hiện gieo hạt.

Để xử lý trong giai đoạn gieo hạt và vườn ươm của cây trồng được canh tác để cấy ghép cây trồng, mong muốn là hạt giống được xử lý trực tiếp hoặc sản phẩm ở dạng lỏng được áp dụng qua tưới tiêu cho, hoặc sản phẩm ở dạng hạt được phun trên, nền vườn ươm. Cũng mong muốn áp dụng sản phẩm ở dạng hạt cho lỗ trồng cây ở thời điểm trồng cây cuối cùng, hoặc trộn nó với chất mang trồng trọt gần vị trí cấy ghép.

Thuốc trừ sâu nông nghiệp/ngành làm vườn được đề xuất theo sáng chế thường được tạo thành dạng thuận tiện cho sử dụng, theo phương pháp thông thường của dạng bào chế của hóa chất nông nghiệp.

Cụ thể là, hợp chất oxazepin hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có thể được trộn thành chất mang trợ phù hợp, theo tỷ lệ phù hợp, cùng với chất phụ trợ, nếu cần, và được hòa tan, được phân tách, được tạo huyền phù, được trộn, được ngâm, được hấp thụ hoặc được gắn, và được bào chế thành dạng

phù hợp như huyền phù, nhũ tương, chất lỏng, bột có thể thấm ướt, hạt có thể phân tán trong nước, hạt, bột, viên nén, gói, v.v., để sử dụng.

Chế phẩm theo sáng chế (thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn hoặc chất kiểm soát ký sinh trùng động vật sinh học) có thể chứa, ngoài thành phần hoạt tính của nó, thành phần phụ gia của chúng thường được sử dụng trong hóa chất nông nghiệp hoặc chất kiểm soát ký sinh trùng động vật sinh học, nếu cần. Thành phần phụ gia của chúng bao gồm chất mang rắn, chất mang lỏng, và các chất mang khác, chất hoạt tính bề mặt, chất phân tán, chất làm ướt, chất liên kết, chất dính, chất làm đầy, chất tạo màu, chất ổn định, chất phân tán, chất chống đông, chất chống đóng băng, chất chống phân rã, chất ổn định, v.v.. Ngoài các chất trên đây, chất bảo quản, mảnh thực vật, v.v., có thể cũng được sử dụng làm chất phụ gia, nếu cần. Bất kỳ trong số những chất phụ gia này có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc hai hoặc nhiều loại có thể được kết hợp.

Chất mang rắn bao gồm, ví dụ thạch anh, đất sét, cao lanh, pyrophyllit, serixit, bột tan, bentonit, đất sét có tính axit, attapungit, zeolit, đất tảo cát và các chất khoáng tự nhiên khác, canxi cacbonat, amoni sunfat, natri sunfat, kali clorua và các muối vô cơ khác, axit silixic tổng hợp, silicat tổng hợp, tinh bột, xenluloza, bột cây (như mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô, thân cây thuốc lá, v.v..) và các chất mang rắn hữu cơ khác, polyetylen, polypropylen, polyvinyliden clorua và các chất mang nhựa khác, urê, ống rỗng vô cơ, ống rỗng nhựa, silica khói (cacbon trắng), v.v.. Bất kỳ trong số những chất này có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc hai hoặc nhiều loại có thể được kết hợp.

Chất mang lỏng bao gồm, ví dụ rượu như metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol và các rượu monohydric khác, etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, hexylen glycol, polyetylen glycol, polypropylen glycol, glyxerin, và các rượu polyhydric khác, propylen glycol ete và các hợp chất rượu polyhydric, axeton, metyl etyl keton, metyl isobutyl keton, diisobutyl keton, xyclohexanon và các keton khác, etyl ete, dioxan, etylen glycol monoetyl ete, dipropyl ete, THF, và các ete khác, parafin thông thường, naphten, isoparafin, kerosen, dầu khoáng và hydrocacbon axit béo khác, benzen, toluen, xylen, naphta dung môi, alkyl naphtalen và các hydrocacbon thơm khác, diclorometan, clorofom, cacbon tetracolorua và các hydrocacbon được halogen hóa khác, etyl axetat, diisopropyl phtalat, dibutyl phtalat, dioctyl phtalat, dimetyl adipat và các

este khác, γ -butyrolacton và các lacton khác, dimetyl focmamit, dietyl focmamit, dimetyl axetamit, N-alkyl pyrrolidinon và các amit khác, axetonitril và các nitril khác, dimetyl sulfoxit và các hợp chất lưu huỳnh khác, dầu đậu tương, dầu hạt cải, dầu hạt bông, dầu thầu dầu và các loại dầu thực vật khác, nước, v.v.. Bất kỳ trong số những chất này có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc hai hoặc nhiều loại có thể được kết hợp.

Chất hoạt tính bề mặt được sử dụng làm chất phân tán và chất làm ướt bao gồm, ví dụ este của axit béo sorbitan, polyoxyetylen este của axit béo sorbitan, este của axit béo sucroza, este của axit béo polyoxyetylen, este của axit nhựa polyoxyetylen, dieste của axit béo polyoxyetylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkyl aryl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete, polyoxyetylen dialkyl phenyl ete, sản phẩm ngưng tụ của polyoxyetylen alkyl phenyl ete focmalin, copolyme hóa khối polyoxyetylen polyoxypropylen, polyme hóa khối polystyren polyoxyetylen, ete của copolyme hóa khối alkyl polyoxyetylen polypropylen, polyoxyetylen alkyl amin, amit của axit béo polyoxyetylen, bisphenyl ete của axit béo polyoxyetylen, polyalkylen benzyl phenyl ete, polyoxyalkylen styryl phenyl ete, axetylen diol, axetylen diol được bổ sung polyoxyalkylen, silicon kiểu polyoxyetylen ete, silicon kiểu este, chất hoạt tính bề mặt flo, dầu thầu dầu polyoxyetylen, dầu thầu dầu được làm cứng bằng polyoxyetylen và các chất hoạt tính bề mặt không ion khác, alkyl sunfat, polyoxyetylen alkyl ete sunfat, polyoxyetylen alkyl phenyl ete sunfat, polyoxyetylen styryl phenyl ete sunfat, alkyl benzen sunfonat, alkyl aryl sunfonat, lignin sunfonat, alkyl sulfosuccinat, naphtalen sunfonat, alkyl naphtalen sunfonat, muối của sản phẩm ngưng tụ focmalin của axit naphtalen sulfonic, muối của sản phẩm ngưng tụ focmalin của alkyl naphtalen sunfonat, muối của axit béo, polycacbonat, polyacrylat, sarcoxinat của axit béo N-metyl, muối của axit nhựa, polyoxyetylen alkyl ete phosphat, polyoxyetylen alkyl phenyl ete phosphat và các chất hoạt tính bề mặt anion khác, lauryl amin hydroclorua, stearyl amin hydroclorua, oleyl amin hydroclorua, stearyl amin axetat, stearyl aminopropyl amin axetat, alkyl trimetyl amoni clorua, alkyl dimetyl benzalkoni clorua và các muối alkyl amin khác và các chất hoạt tính bề mặt cation khác, chất hoạt tính bề mặt kiểu axit amino hoặc kiểu betain và các chất hoạt tính bề mặt lưỡng tính khác, v.v.. Bất kỳ trong số

những chất hoạt tính bề mặt này có thể được sử dụng riêng rẽ hoặc hai hoặc nhiều loại có thể được kết hợp.

Chất liên kết và chất kết dính bao gồm, ví dụ carboxy methylxenluloza và muối của chúng, dextrin, tinh bột có thể hòa tan trong nước, gôm xantan, gôm guar, sucroza, polyvinyl pyrrolidon, gôm Ả rập, rượu polyvinyl, polyvinyl axetat, natri polyacrylat, polyetylen glycol với trọng lượng phân tử trung bình nằm trong khoảng từ 6000 đến 20000, polyetylen ôxit với trọng lượng phân tử trung bình nằm trong khoảng từ 100000 đến 5000000, phospholipit (như xephalin, lexitin, v.v.), bột xenluloza, dextrin, tinh bột được xử lý, hợp chất chelat polyamino carboxylic, polyvinyl pyrrolidon liên kết chéo, maleat và styren copolyme, (meth)acrylat copolyme, este bán phần của rượu polyhydric trên cơ sở polyme và dicarboxylic anhydrua, muối có thể hòa tan trong nước của polystyren sunfonat, parafin, terpen, nhựa polyamit, polyacrylat, polyoxyetylen, sáp, polyvinyl alkyl ete, sản phẩm ngưng tụ fomalal của alkyl phenol, nhựa nhũ tương tổng hợp, v.v..

Chất làm đầy bao gồm, ví dụ gôm xantan, gôm guar, gôm diutan, carboxy methyl xenluloza, polyvinyl pyrrolidon, carboxy vinyl polyme, acrylic polyme, hợp chất tinh bột, polysaccharit và polyme có thể hòa tan trong nước, bentonit có độ tinh khiết cao, silica khói (cacbon trắng) và các bột mịn vô cơ khác, v.v..

Chất tạo màu bao gồm, ví dụ ôxit sắt, ôxit titan, chất màu xanh Phô và các chất màu vô cơ khác, thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo, thuốc nhuộm phtanoxyanin kim loại và các thuốc nhuộm hữu cơ khác, v.v..

Chất chống đông bao gồm, ví dụ etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, glyxerin và các rượu polyhydric khác, v.v..

Chất phụ trợ để ngăn chặn đóng tảng hoặc thúc đẩy sự phân rã bao gồm, ví dụ tinh bột, axit alginic, mannoza, galactoza và các polysaccharit khác, polyvinyl pyrrolidon, silica khói (cacbon trắng), gôm este, nhựa dầu mỏ, natri tripolyphosphat, natri hexametaphosphat, muối kim loại stearat, bột xenluloza, dextrin, metacrylat este copolyme, polyvinyl pyrrolidon, hợp chất chelat polyamino carboxylic, styren-isobutylen-maleat anhydrua copolyme được sunfonat hóa, copolyme kết hợp của tinh bột-polyacrylonitril, v.v..

Chất ổn định bao gồm, ví dụ zeolit, vôi sống, magie ôxit và các chất làm khô khác, hợp chất phenol, hợp chất amin, hợp chất lưu huỳnh, hợp chất phosphat và các chất chống ôxy hóa khác, hợp chất salixylat, hợp chất benzophenon và các chất hấp thụ tia cực tím khác, v.v..

Chất bảo quản bao gồm, ví dụ kali sorbat, 1,2-benzothiazolin-3-one, v.v..

Hơn nữa, chất phân tán chức năng, piperonyl butoxit và các chất ức chế phân chia trao đổi chất khác và các chất tăng cường hoạt tính khác, hydroxytoluen được butyl hóa (BHT) và các chất chống ôxy hóa khác, chất hấp thụ tia cực tím và các chất phụ trợ khác có thể cũng được sử dụng, nếu cần.

Tỷ lệ trộn của thành phần hoạt tính hợp chất có thể tăng hoặc giảm nếu cần, đến mức độ được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,01 đến 90 phần khối lượng so với 100 phần khối lượng của thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế. Trong trường hợp đối với bột, hạt, nhũ tương hoặc bột có thể thấm ướt, ví dụ 0,01 đến 50 phần khối lượng (0,01 đến 50% theo khối lượng so với tổng khối lượng của thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn) là phù hợp.

Lượng bao nhiêu thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế được sử dụng thay đổi phụ thuộc vào nhiều nhân tố, như mục đích, côn trùng gây hại được kiểm soát, điều kiện sinh trưởng của cây trồng, xu hướng hình thành của côn trùng gây hại, thời tiết, điều kiện môi trường, dạng sản phẩm, phương pháp áp dụng, vị trí áp dụng, thời gian áp dụng, v.v..; tuy nhiên, lượng mong muốn của thành phần hoạt tính hợp chất có thể được chọn phù hợp nằm trong khoảng từ 0,001 g đến 10 kg, hoặc tốt hơn, nếu từ 0,01 g đến 1 kg, trên 10 A.

Thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn được đề xuất theo sáng chế có thể được trộn với các thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn khác, thuốc diệt ve, bét, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt vi khuẩn, hóa chất nông nghiệp sinh học, v.v., nhằm mục đích mở rộng phạm vi của côn trùng gây hại được kiểm soát và thời gian mà có thể được kiểm soát chúng, hoặc để giảm lượng hóa chất, hoặc nó có thể là được trộn với thuốc diệt cỏ, chất kiểm soát sinh trưởng cây trồng, phân bón, v.v., phụ thuộc vào vị trí áp dụng.

Ví dụ của các thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn, thuốc diệt ve, bét, thuốc diệt giun tròn khác được sử dụng cho mục đích nêu trên bao gồm, trong số các thuốc khác là 3,5-xylyl metylcarbamat (XMC), *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, độc tố protein tinh thể được tạo ra trên cơ sở *Bacillus thuringiensis*, BPMC, hợp chất trừ sâu có độc tố Bt, CPCBS (clofenson), DCIP (diclorodiisopropyl ete), D-D (1,3-Dicloropropen), DDT, NAC, O-4-dimetylsulfamoylphenyl O,O-dietyl phosphorothioat (DSP), O-etyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat (EPN), tripropylisoxyanurat (TPIC), acrinathrin, azadirachtin, axynonapyr, azinphos-metyl, axequinoxyl, axetamiprit, axetoprol, axephat, abamectin, afidopyropen, avermectin-B, amidoflomet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, alpha-endosulfan, alpha-xypermethrin, albendazol, allethrin, isazofos, isamidofos, isoamidofos, isoxathion, isoxycloseram, isofenphos, isoprocarb (MIPC), epsilon-metofluthrin, epsilon-momflothrín, ivermectin, imicyafos, imidacloprít, imiprothrin, indoxacarb, esfenvalerat, ethiofencarb, ethion, ethiprol, etoxazol, ethofenprox, ethoprophos, etrimfos, emamectin, emamectin-benzoat, endosulfan, empenethrin, oxazosulfyl, oxamyl, oxydemeton-metyl, oxydeprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, kali oleat, natri oleat, cadusafos, kappa-bifenthrin, cartap, carbaryl, carbosulfan, carbofuryl, gamma-xyhalothrin, xylylcarb, quinalphos, kinopren, chinometionat, cloethocarb, clothianidin, clofentezin, chromafenozit, cloantraniliprol, cloetoxifyos, clodimeform, clodan, clopyrifos, clopyrifos-metyl, clophenapyr, clofenson, clofenvinphos, clofluazuron, clorobenzilat, clorobenzoat, cloroprallethrin, dicofol, salithion, xyanophos (CYAP), diafenthiuron, diamidafos, xyantraniliprol, theta-xypermethrin, dienoclo, xyetpyrafen, xyenopyrafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-xypermethrin, xyclobutrifluram, diclofenthion (ECP), xycloprothrin, diclovos (DDVP), dicloromezotiaz, disulfoton, dinotefuryl, xyhalodiamit, xyhalothrin, xyphenothrin, xyfluthrin, diflubenzuron, xyflumetofen, diflovidazin, xyhexatin, xypermethrin, dimetylvinphos, dimetoat, dimpropyridaz, dimefluthrin, silafluofen, xyromazin, spinetoram, spinosad, spiroidiclofen, spirotetramat, spiropidion, spiromesifen, sulfluramit, sulprofos, sulfoxaflor, zeta-xypermethrin, diazinon, tau-fluvalinat, dazomet,

thiacloprid, thiametoxam, tiozafen, thiodicarb, thioxyclo, thiosulphate, thiosulphate-sodium, thionazin, thiomethon, tyclopyrazoflor, deet, dieldrin, tetrachlorantraniliprol, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetraniliprol, tetramethylfluthrin, tetramethrin, tebupirimfos, tebufenozit, tebufenpyrad, tefluthrin, teflubenzuron, demeton-S-methyl, temephos, deltamethrin, terbufos, tralopyril, tralomethrin, transfluthrin, triazamat, triazuron, trichloramit, trichlorophen (DEP), triflumuron, tolfenpyrad, naled (BRP), nicofluprol, nithiazin, nitenpyram, novaluron, noviflumuron, hydropren, vaniliprol, vamidothion, parathion, parathion-methyl, halfenprox, halofenozit, bistrifluron, bisulphate, hydramethylnon, tinh bột hydroxy propyl, binapacryl, pyflubumit, bifenazat, bifenthrin, pymetrozin, pyraclofos, pyrafluprol, pyridafenthion, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprol, pyriproxyfen, pirimicarb, pyrimidifen, pirimiphos-methyl, pyrethrins, fipronil, fenazaquin, fenamiphos, bromopropylat, fenitrothion (MEP), fenoxycarb, fenothiocarb, phenothrin, fenobucarb, fensulfothion, fenthion (MPP), phenthoat (PAP), fenvalerat, fenpyroximat, fenpropathrin, fenbendazol, formetanat, butathiofos, buprofezin, furathiocarb, prallethrin, fluacrypyrim, fluazaindolizin, fluazinam, fluazuron, fluensulfon, fluxametamit, fluxyclozuron, flucythrinate, fluvalinate, flupyrzofos, flupyrimin, flufenimer, flufenoxuron, flufenzin, flufenoprox, fluproxyfen, flubrocycythrinate, fluhexafon, flubendiamit, flupentiofenox, flumethrin, flurimfen, prothiofos, protrifenbut, flonicamit, propaphos, propargit (BPPS), profenofos, broflanilit, profluthrin, propoxur (PHC), flometoquin, alpha-bromadiolon, bromopropylat, beta-cyfluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, heptafluthrin, heptenophos, permethrin, benclotiaz, bendiocarb, benzpyrimoxan, bensulphate, benzoximat, benfuracarb, phoxim, phosalon, fothiazat, fothietan, phosphamidon, phosphocarb, phosmet (PMP), polynactins, formetanat, formothion, phorat, dầu máy, malathion, milbemycin, milbemycin-A, milbemectin, mecarbam, mesulfenfos, metomyl, metaldehyt, metaflumizon, metamidophos, metam-amoni, metam-natri, methiocarb, methidathion (DMTP), methylisothioxyanat, methylneodecanamit, methylparathion, metoxadiazon, metoxyclo, metoxyfenozit, metofluthrin, metopren, metolcarb, meperfluthrin, mevinphos, monocrotophos, monosulphate, lambda-xyhalothrin, ryanodin, lufenuron, rescalure, resmethrin, lepimectin, rotenon, levamisol hydrochlorua, fenbutatin

ôxit, morantel tartarat, metyl bromit, xyhexatin, canxi xyanamit, canxi polysulfit, lưu huỳnh, và nicotin-sunfat.

Ví dụ của thuốc diệt nấm dùng trong ngành nông nghiệp/ngành làm vườn được sử dụng cho mục đích tương tự bao gồm, trong số các thuốc khác aureofungin, azaconazol, azithiram, axypetacs, axibenzolar, axibenzolar-S-metyl, azoxystrobin, anilazin, amisulbrom, ampropylfos, ametoctradin, rượu allyl, aldimorph, amobam, isotianil, isovaledion, isopyrazam, isofetamit, isofluxypram, isoprothiolan, ipconazol, ipfentrifluconazol, ipflufenquin, iprodion, iprovalicarb, iprobenfos, imazalil, iminoctadin, iminoctadin-albesilat, iminoctadin-triaxetat, imibenconazol, inpyrfluxam, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenphos, etaconazol, ethaboxam, ethirimol, etem, etoxyquin, etridiazol, enestroburin, enoxastrobin, epoxiconazol, oxadixyl, oxathiapiprolin, oxycarboxin, đồng-8-quinolinolat, oxytetracyclin, đồng-oxinat, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarat, axit oxolinic, othilinin, ofurax, orysastrobin, chất khử trùng đất như metam-natri, kasugamycin, carbamorph, carpropamit, carbendazim, carboxin, carvon, quinazamit, quinaxetol, quinoxifen, quinofumelin, chinometionat, captafol, captan, kiralaxyl, quinconazol, quintozen, guazatin, cufraneb, cuproban, coumoxystrobin, glyodin, griseofulvin, climbazol, cresol, kresoxim-metyl, clozolinat, clotrimazol, clobenthiazon, cloaniformetan, cloanil, cloquinox, cloropicrin, clofenazol, clorodinitronaphthalen, clorothalonil, cloroneb, zarilamit, salixylanilit, xyazofamit, diethyl pyrocacbonat, diethofencarb, xyclafuramit, dicloxymet, diclozolin, diclobutrazol, diclofluanit, xycloheximit, diclobentiazox, diclomezin, dicloran, diclorophen, diclon, disulfiram, ditalimfos, dithianon, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinocron, dinosulfon, dinoterbon, dinobuton, dinopenton, dipyrithion, diphenylamin, difenoconazol, xyflufenamid, diflumetorim, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, xypendazol, simeconazol, dimethirimol, dimetomorph, xymoxanil, dimoxystrobin, metyl bromit, ziram, silthiofam, streptomycin, spiroxamin, sultropen, sedaxan, zoxamit, dazomet, thiadiazin, tiadinil, thiadifluor, thiabendazol, tioxymit, thioquinox, thioclofenphim, thiophanat, thiophanat-metyl, thixyofen, thifluzamit, thiram, decafentin, tecnazen, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, axit dehydroaxetic, tebuconazol, tebufloquin, dodixin, dodin, muối đồng [II] của axit dodexylbenzensulphonic

bisetylendiamin (DBEDC), dodemorph, drazoxolon, triadimenol, triadimefon, triazbutil, triazoxit, triamiphos, triarimol, trichlamit, triclopyricarb, tricyclazol, triticonazol, tridemorph, tributyltin ôxit, triflumizole, trifloxystrobin, triforin, tolylfluanit, tolclofos-metyl, natamycin, nabam, nitrothal-isopropyl, nitrostyren, nuarimol, ðồng nonylphenol sunfonat, halacrinat, validamycin, valifenalat, harpin protein, picarbutrazox, bixafen, picoxystrobin, picobenzamit, pydiflumetofen, bithionol, bitertanol, hydroxyisoxazol, hydroisoxazol-kali, binapacryl, biphenyl, piperalin, hymexazol, pyraoxystrobin, pyracarbolit, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrapropoyn, pyrametostrobin, pyrioferon, pyridinitril, pyrisoxazol, pyridaclometyl, pyrifenox, pyribencarb, pyriminostrobin, pyrimetanil, pyroxylo, pyroxyfur, pyroquilon, vinclozolin, famoxadon, fenapanil, fenamidon, fenaminosulf, fenaminstrobin, fenarimol, fenitropan, fenoxanil, ferimzon, ferbam, fentin, fenciclonil, fencicloxamit, fenpyrazamin, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fenhexamit, phitanit, buthiobat, butylamin, bupirimat, fuberidazol, blastixidin-S, furametpyr, furalaxyl, fluacrypyrim, fluazinam, fluindapyr, fluoxastrobin, fluoxapiprolin, fluotrimazol, fluopicolit, fluopimomit, fluopyram, floimit, furcarbanil, fluxapyroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonil, flusilazol, flusulfamit, flutianil, flutolanil, flutriafol, flufenoxystrobin, furfural, flubeneteram, furmexyclox, flumetover, flumorph, proquinazit, procloaz, procymidon, prothiocarb, prothioconazol, pronitridin, propamocarb, propiconazol, propineb, furophanat, probenazol, bromuconazol, florylpicloxamit, hexachlorobutadien, hexaconazol, hexylthiofos, bethoxazin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, pefurazoat, benquinox, penconazol, benzamorf, penxycuron, axit benzohydroxamic, bentalluron, benthiazol, benthiavalicarb-isopropyl, penthiopyrad, penflufen, boscalit, phosdiphen, fosetyl, fosetyl-Al, polyoxin, polyoxorim, polycarbamat, folpet, formaldehyt, ðầu máy, maneb, mancozeb, mandipropamit, mandestrobin, myclozolin, myclobutanil, mildiomyxin, milneb, mecarbinzit, metasulfocarb, metazoxolon, metam, metam-natri, metalaxyl, metalaxyl-M, metiram, metyl isothioxyanat, mephtyldinocap, metyltetraprol, metconazol, metsulfovax, methfuroxam, metominostrobin, metrafenon, mepanipirim, mefenoxam, mefentrifluconazol, meptyldinocap, mepronil, mebenil, iodometan, rabenzazol, benzalkoni clorua, clorua ðồng bazơ, sunfat ðồng bazơ, thuốc

diệt vi khuẩn vô cơ như bạc, natri hypoclorot, cupric hydroxit, lưu huỳnh có khả năng thấm ướt, canxi polysulfit, kali hydro cacbonat, natri hydro cacbonat, lưu huỳnh, đồng sunfat anhydrua, niken dimetyldithiocarbamat, hợp chất đồng như đồng 8-hydroxy quinolin (đồng oxin), sunfat kẽm, và pentahydrat sunfat đồng.

Tương tự, ví dụ của thuốc diệt cỏ bao gồm, trong số các thuốc khác, 1-naphthylaxetamit, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA thioethyl, MCPB, ioxynil, aclonifen, azafenidin, axifluorfen, aziprotryn, azimsulfuron, asulam, axetoclo, atrazin, atraton, anisuron, anilofos, aviglyxin, axit absxisic, amicarbazone, amidosulfuron, amitrol, aminoxyclopyraclo, aminopyralit, amibuzin, amiprofos-metyl, ametrion, ametryn, alaclo, allidoclo, alloxydim, alorac, iofensulfuron, isouron, isocarbamit, isoxaclofop, isoxapyrifop, isoxaflutol, isoxaben, isoxil, isonoruron, isoproturon, isopropalin, isopolinat, isomethiozin, inabenzide, ipazin, ipfencarbazone, iprymidam, imazaquin, imazapic, imazapyr, imazametapyr, imazametabenz, imazametabenz-metyl, imazamox, imazethapyr, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, axit indolebutyric, uniconazol-P, eglinazin, esprocarb, etametsulfuron, etametsulfuron-metyl, etalfluralin, etiolat, etyclozat etyl, etidimuron, etinofen, etephon, etoxysulfuron, etoxyfen, etniproxit, etofumesat, etobenzanil, epyrifenacil, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargyl, oxaziclonofen, oxasulfuron, oxapyrazon, oxyfluorfen, oryzalin, orthosulfamuron, orbencarb, cafenstrol, cambendiclo, carbasulam, carfentrazone, carfentrazone-ethyl, karbutilat, carbetamit, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-ethyl, xylaclo, quinclamin, quinonamit, quinclorac, quinmerac, cumyluron, clacifos, clidinat, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P, credazin, cletodim, cloxyfop, clodinafop, clodinafop-propargyl, clorotoluron, clopyralit, cloproxydim, cloprop, clobromuron, clofop, clomazon, clometoxynil, clometoxyfen, clomeprop, cloazifop, cloazin, cloransulam, cloanocryl, cloamben, cloransulam-metyl, clodiazon, cloimuron, cloimuron-ethyl, closulfuron, clothal, clothiamit, clonitrofen, clofenac, clofenprop, clobufam, cloflurazol, cloflurenol, cloprocarb, clopropham, clomequat, cloeturon, cloroxynil, cloroxuron, cloropon, saflufenaxil, xyanazin, xyanatryl, di-allat, diuron, dietamquat, dicamba, xycluron, xycloat, xycloxydim, diclosulam, xyclosulfamuron,

xyclopyranil, xyclopyrimorat, dicloprop, dicloprop-P, diclobenil, diclofop, diclofop-
 metyl, diclomat, dicloalure, diquat, xisanilit, disul, siduron, dithiopyr, dinitramin,
 xinidon-etyl, dinosam, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenat, dinoprop, xyhalofop-
 butyl, diphenamid, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, xybutryn, xyprazin,
 xyprazol, diflufenican, diflufenzopyr, dipropetryn, xypromid, xyperquat, gibberellin,
 simazin, dimexano, dimesulfazet, dimetaclo, dimidazon, dimetametryn, dimetenamid,
 simetryn, simeton, dimepiperat, dimefuron, xinmetylin, swep, sulglycapin, sulcotrion,
 sulfallat, sulfentrazon, sulfosulfuron, sulfometuron, sulfometuron-metyl, secbumeton,
 setoxydim, sebuthylazin, terbacil, daimuron, dazomet, dalapon, thiazafluron, thiazopyr,
 tiafenacil, thiencarbazon, thiencarbazon-metyl, tiocarbazil, tioclorim, thiobencarb,
 thidiazimin, thidiazuron, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, desmedipham,
 desmetryn, tetflupyrolimet, tetrafluron, thenylclo, tebutam, tebuthiuron, terbumeton,
 tepraloxydim, tefuryltrion, tembotrion, delaclo, terbacil, terbucarb, terbuclo,
 terbuthylazin, terbutryn, topramezon, tralkoxydim, triaziflam, triasulfuron, triafamon,
 tri-allat, trietazin, tricamba, triclopyr, tridiphan, tritac, tritosulfuron, trifludimoxazin,
 triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, trifluralin, trifloxysulfuron, tripropindan,
 tribenuron-metyl, tribenuron, trifop, trifopsim, trimeturon, tolpypalat, naptalam,
 naproanilit, napropamit, nicosulfuron, nitratin, nitrofen, nitrofluorfen, nipyraclufen,
 neburon, norflurazon, noruron, barban, paclobutrazol, paraquat, parafluron, haloxydin,
 halauxifen, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-metyl, halosafen, halosulfuron,
 halosulfuron-metyl, bixlozon, picloram, picolinafen, bixyclopyron, bispyribac,
 bispyribac-natri, pydanon, pinoxaden, bifenox, piperophos, hymexazol, pyraclonil,
 pyrasulfotol, pyrazoxyfen, pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyl, pyrazolat, bilanafos,
 pyraflufen-etyl, pyriclor, pyridafol, pyriethiobac, pyriethiobac-natri, pyridat, pyrifthalid,
 pyributicarb, pyribenzoxim, pyrimisulfan, primisulfuron, pyriminobac-metyl,
 pyroxasulfon, pyroxulam, fenasulam, phenisopham, fenuron, fenoxasulfon,
 fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyl, phenothiol, fenoprop, phenobenzuron,
 fenquinotrion, fenthiaprop, fenteracol, fentrazamit, phenmedipham, phenmedipham-
 etyl, butaclo, butafenacil, butamifos, buthiuron, buthidazol, butylat, buturon, butenaclo,
 butroxydim, butralin, flazasulfuron, flamprop, furyloxyfen, prynaclo, primisulfuron-

metyl, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazolat, fluroxypyr, fluothiuron, fluometuron, floglycofen, flurocloidon, flodifen, flonitrofen, flomidin, flucarbazon, flucarbazon-natri, flucloalin, flucetosulfuron, fluthiaxet, fluthiaxet-metyl, flupyr-sulfuron, flufenaxet, flufenican, flufenpyr, flupropaxil, flupropanat, flupoxam, flumioxazin, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumipropyn, flumezin, fluometuron, flumetsulam, fluridon, flurtamon, fluroxypyr, pretilaclo, proxan, proglinazin, proxyazin, prodiamin, prosulfalin, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclo, propazin, propanil, propyzamit, propisoclo, prohydrojasmon, propyrisulfuron, propham, profluzol, profluralin, prohexadion-canxi, propoxycarbazon, propoxycarbazon-natri, profoxydim, bromacil, brompyrazon, prometryn, prometon, bromoxynil, bromofenoxim, bromobutit, bromobonil, florasulam, florpyrauxifen, hexachloroaxeton, hexazinon, petoxamit, benazolin, penoxsulam, pebulat, beflubutamit, beflubutamit-M, vernolat, perfluidon, bencarbazon, benzadox, benzipram, benzylaminopurin, benzthiazuron, benzfendizon, bensulide, bensulfuron-metyl, benzoylprop, benzobixyclon, benzofenap, benzofluor, bentazon, pentanoclo, benthioncarb, pendimetalin, pentoxazon, benfluralin, benfuresat, fosamin, fomesafen, foramsulfuron, forclofenuron, maleic hydrazit, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrion, mesoprazin, metoprotryn, metazaclo, metazol, metazosulfuron, metabenzthiazuron, metamitron, metamifop, metam, metalpropalin, metiuron, metiozolin, metiobencarb, metyldymron, metoxuron, metosulam, metsulfuron, metsulfuron-metyl, metflurazon, metobromuron, metobenzuron, metometon, metolaclo, metribuzin, mepiquat-clorua, mefenacet, mefluidit, monalit, monisouron, monuron, axit monocloroaxetic, monolinuron, molinat, morfamquat, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, iodobonil, iodometan, lactofen, lancotrion, linuron, rimsulfuron, lenaxil, rodetanil, canxi peroxit, và metyl bromua.

Ngoài ra, hiệu quả tương tự có thể được mong đợi bằng cách trộn với hóa chất nông nghiệp sinh học, như virus nhiều mặt hạt nhân (NPV), virus granulosis (GV), virus xytoplasmic polyhedrosis (CPV), virus entomopoxi (EPV) và các chất chứa virus khác, *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai*, *Pasteuria penetrans*, và các hóa chất nông nghiệp vi trùng khác được sử dụng làm thuốc

diệt côn trùng hoặc thuốc diệt giun tròn, *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobacter*, *Erwinia carotovora*, *Bacillus subtilis*, và các hóa chất nông nghiệp vi trùng khác được sử dụng làm thuốc diệt vi khuẩn, *Xanthomonas campestris* và các hóa chất nông nghiệp sinh học được sử dụng làm thuốc diệt cỏ, và thuốc tương tự.

Hơn nữa, cũng có thể trộn hóa chất nông nghiệp sinh học này như *Onshitsutsuyakobachi* (*Encarsia formosa*), *Koremanaburabachi* (*Aphidius colemani*), *Shokugatamabae* (*Aphidoletes aphidimyza*), *Isaeahimekobachi* (*Diglyphus isaea*), *Hamogurikomayubachi* (*Dacnusa sibirica*), *Chirikaburidani* (*Phytoseiulus persimilis*), *Kukumerisukaburidani* (*Amblyseius cucumeris*), *Namihimehanakamemushi* (*Orius sauteri*), và các côn trùng ăn mồi sống tự nhiên khác, *Beauveria brongniartii* và các hóa chất nông nghiệp vi trùng khác, (Z)-10-tetradexenyl=acetat, (E,Z)-4,10-tetradecadienyl=acetat, (Z)-8-dodexenyl=acetat, (Z)-11-tetradexenyl=acetat, (Z)-13-icosen-10-one, 14-metyl-1-octadexen, và các chất pheromon khác.

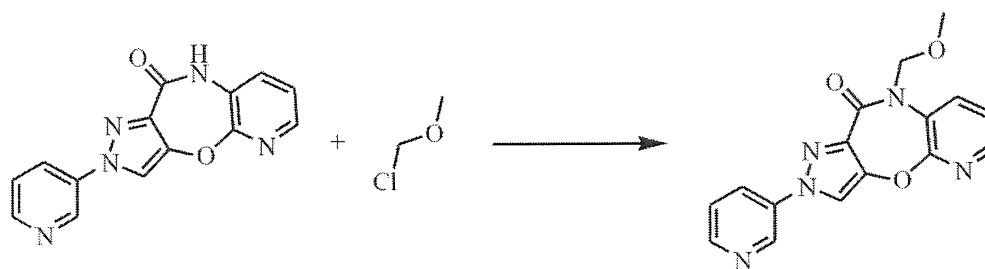
Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ tiêu biểu của sáng chế được thể hiện dưới đây, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở những ví dụ này.

Ví dụ sản xuất 1.

Sản xuất 9-(metoxymetyl)-2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-f]pyrido[2,3-b][1,4]oxazepin-10(9H)-one (Hợp chất số 1-1)

công thức 5



Natri hydrua (1,75 g, 43,8 mmol) được bổ sung để làm khô dung dịch DMF THF/khô (240 mL/60 mL) của 2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-f]pyrido[2,3-b][1,4]oxazepin-10(9H)-one (8,16 g, 29,2 mmol) ở 0°C và được khuấy trong vòng 30 phút ở nhiệt độ phòng. Dung dịch phản ứng was cooled again to 0°C, after which chloromethylmetyl ete (4,14 g, 49.6 mmol) được bổ sung thereto, và hỗn hợp was được

khuấy trong vòng 4 giờ ở nhiệt độ phòng. Dung dịch phản ứng được rót vào dung dịch có nước của amoni clorua bão hòa (400 mL), giữ qua đêm. Thành phần thô không được phản ứng được kết tủa được lọc sử dụng phễu lọc Buchner. Dịch lọc được chiết bằng etyl axetat/THF (ca. 1/1), được rửa bằng nước và nước muối bão hòa từng lần, và lớp hữu cơ được làm khô sử dụng magie sunfat khan, và sau đó được cô bằng chân không. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột geo silica NH, tinh thể thu được được rửa bằng etyl axetat, và sau đó được lọc, để thu được hợp chất cần điều chế (4,36 g, 13,5 mmol).

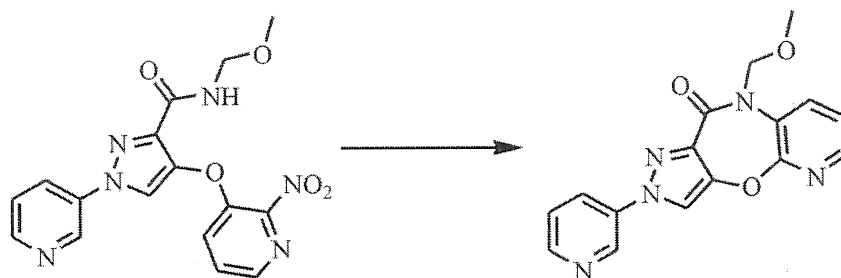
Hiệu suất: 46%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 209-210°C

Ví dụ sản xuất 2.

Sản xuất 9-(metoxymetyl)-2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-f]pyrido[2,3-b][1,4]oxazepin-10(9H)-one (Hợp chất số 1-1)

công thức 6



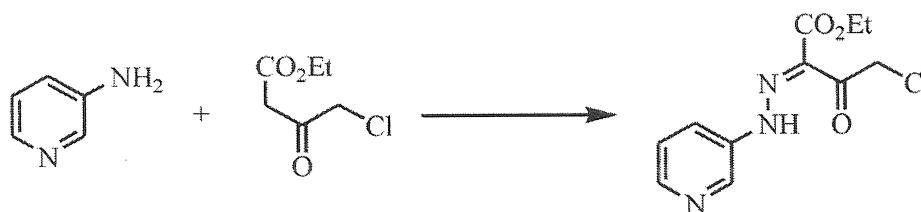
Kali cacbonat (2,00 g, 14,0 mmol) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (45 mL) của N-(metoxymetyl)-4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit (2,00 g, 14,0 mmol), và được khuấy trong vòng 2 giờ dưới sự làm nóng hồi lưu. Dung dịch phản ứng được lọc sử dụng Xelit ở trạng thái duy trì nhiệt làm nóng, và dịch lọc được cô bằng chân không. Clorofom (15 mL) và dung dịch có nước của amoni clorua bão hòa (1 mL) được bổ sung vào phần còn lại thu được, và lớp hữu cơ được chiết bằng clorofom, sau đó lớp hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa. Lớp hữu cơ được làm khô sử dụng natri sunfat khan, và sau đó được cô bằng chân không để thu được hợp chất cần điều chế (0,71 g, 2,20 mmol).

Hiệu suất: 81%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 209-210°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 1.

Sản xuất ethyl (E)-4-cloro-3-oxo-2-(2-(pyridin-3-yl)hydrazono) butanoat
công thức 7



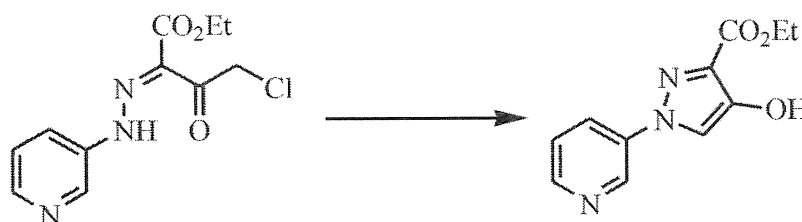
3-Aminopyridin (7,52 g, 80,0 mmol) được bổ sung vào axit clohydric 6N (27 mL, 160 mmol). Trong dung dịch này, dung dịch có nước (40 mL) của natri nitrit (5,52 g, 80,0 mmol) được nhỏ giọt bằng cách giữ nhiệt độ ở 3°C hoặc thấp hơn, và hỗn hợp được khuấy trong vòng 20 phút. Sau đó, ethyl 4-cloaxeto axetat (13,2 g, 80,0 mmol), ethyl axetat (30 mL), natri axetat (15,0 g, 183 mmol) được bổ sung, và được khuấy trong vòng 1 giờ ở 0°C. Ethyl axetat và nước được bổ sung vào dung dịch phản ứng, và lớp hữu cơ được chiết bằng ethyl axetat, sau đó lớp hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa, được làm khô sử dụng magie sunfat khan, và sau đó được cô bằng chân không. Phần còn lại được tinh chế bằng sắc ký cột geo silica, để thu được hợp chất cần điều chế (17,8 g, 66,0 mmol).

Hiệu suất: 82%

Đặc tính vật lý: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , ppm) δ 13,02 (1H,s), 8,67-8,63 (1H,m), 8,47-8,44 (1H,m), 7,75-7,69 (1H,m), 7,41-7,35 (1H,m), 4,69 (2H,m), 4,41 (2H,q), 1,42 (3H,t)

Ví dụ tham khảo sản xuất 2.

Sản xuất ethyl 4-hydroxy-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat
công thức 8



Tert-butoxy kali (7,84 g, 70,0 mmol) được bổ sung vào dung dịch THF (70 mL) của ethyl (E)-4-cloro-3-oxo-2-(2-(pyridin-3-yl)hydrazono) butanoat (17,0 g, 63,0 mmol)

ở 0°C và được khuấy trong vòng 1 giờ ở nhiệt độ phòng. Dung dịch có nước của amoni clorua bão hòa được bổ sung vào dung dịch phản ứng và sau đó lớp hữu cơ được chiết bằng etyl axetat, sau đó lớp hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa, được làm khô sử dụng magie sunfat khan, và sau đó được cô bằng chân không. Tinh thể thu được được rửa bằng hexan/etyl axetat và sau đó được lọc, để thu được hợp chất cần điều chế (12,0 g, 51,4 mmol).

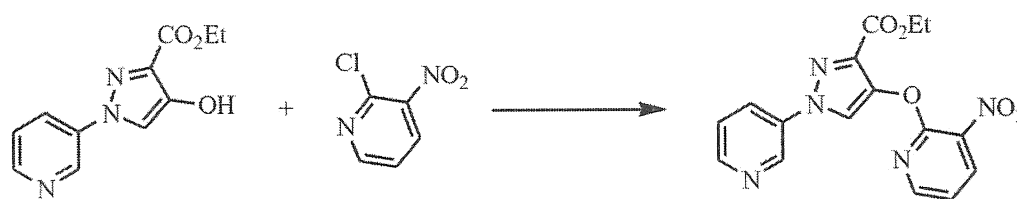
Hiệu suất: 82%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 135-137°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 3.

Sản xuất etyl 4-((3-nitropyridin-2-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat

công thức 9



2-Chloro-3-nitropyridin (14,9 g, 94,3 mmol) và kali cacbonat (16,6 g, 120 mmol) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (400 mL) của etyl 4-hydroxy-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat (20,0 g, 85,8 mmol), và được khuấy trong vòng 1 giờ dưới sự làm nóng hồi lưu. Dung dịch phản ứng được quay trở lại nhiệt độ phòng, và sau đó được lọc sử dụng Xelit, và dịch lọc được cô bằng chân không. Tinh thể thu được được rửa bằng hexan/MTBE và sau đó được lọc để thu được hợp chất cần điều chế (29,3 g, 82,4 mmol).

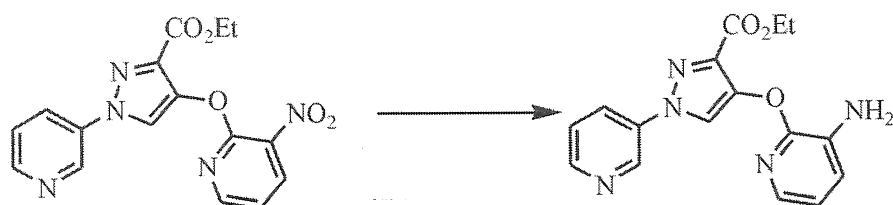
Hiệu suất: 96%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 171-173°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 4.

Sản xuất etyl 4-((3-aminopyridin-2-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat

công thức 10



Amoni clorua (2,20 g, 41,2 mmol) và bột sắt điện phân (23,0 g, 412 mmol) được bổ sung vào dung dịch ethanol/nước (300 mL/150 mL) của ethyl 4-((3-nitropyridin-2-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat (29,3 g, 82,4 mmol), và được khuấy trong vòng 1 giờ dưới sự làm nóng hồi lưu. Dung dịch phản ứng được quay trở lại nhiệt độ phòng, và sau đó được lọc sử dụng Xelit, và dịch lọc được cô bằng chân không. Ethyl axetat và nước được bổ sung vào dung dịch này và lớp hữu cơ được chiết bằng ethyl axetat, sau đó lớp hữu cơ được rửa bằng nước muối bão hòa, được làm khô sử dụng magie sunfat khan, và sau đó được cô bằng chân không. Tinh thể thu được được rửa bằng hexan/MTBE và sau đó được lọc để thu được hợp chất cần điều chế (25,2 g, 77,5 mmol).

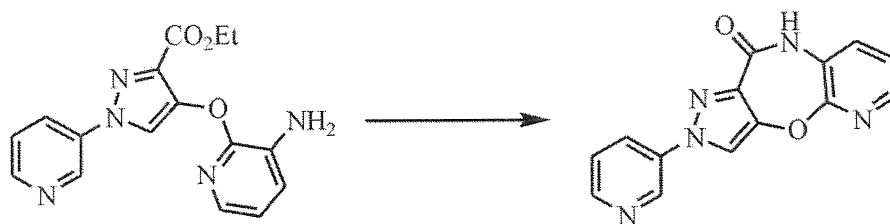
Hiệu suất: 94%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 144-145°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 5.

Sản xuất 2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-f]pyrido[2,3-b][1,4]oxazepin-10(9H)-one

công thức 11



Tert-butoxy kali (9,56 g, 80,9 mmol) được bổ sung vào dung dịch THF (460 mL) của ethyl 4-((3-aminopyridin-2-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat (18,8 g, 57,8 mmol) ở 0°C, và được khuấy trong vòng 1 giờ ở cùng nhiệt độ. Dung dịch phản ứng được rót vào dung dịch có nước của amoni clorua bão hòa (600 mL), và dung dịch được trộn được cô bằng chân không và dung môi được chưng cất. Huyền phù có nước được lọc sử dụng phễu lọc Buchner, và tinh thể được lọc được rửa bằng nước và được

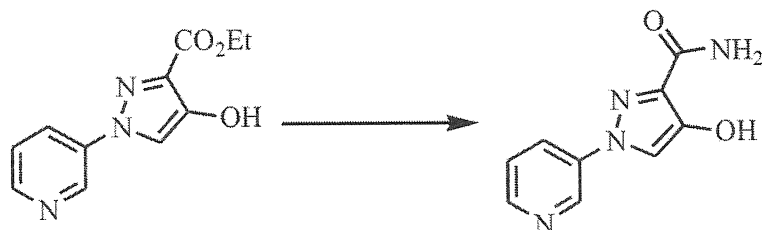
làm khô bằng máy sấy không khí cưỡng bức. Tinh thể thu được được rửa bằng etyl axetat và sau đó được lọc để thu được hợp chất cần điều chế (14,2 g, 50,8 mmol).

Hiệu suất: 88%

Đặc tính vật lý: điểm sôi $>300^{\circ}\text{C}$

Ví dụ tham khảo sản xuất 6.

Sản xuất 4-hydroxy-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit
công thức 12



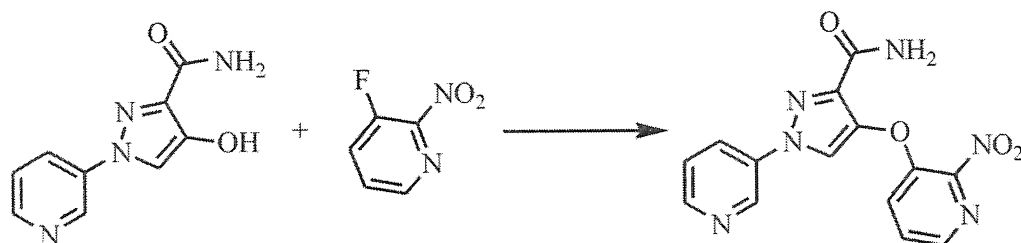
28% Amoniac có nước (20 mL) được bổ sung vào dung dịch ethanol (50 mL) của etyl 4-hydroxy-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxylat (10,0 g, 42,9 mmol), và được khuấy trong vòng 3 giờ dưới sự làm nóng hồi lưu. Trong quá trình phản ứng, 28% amoniac có nước được bổ sung trong các phần 10 mL hàng giờ, và 50 mL của 28% amoniac có nước được sử dụng trong tổng số. Dung dịch phản ứng được quay trở lại nhiệt độ phòng, và sau đó được cô bằng chân không. Tinh thể thu được được rửa bằng etyl axetat và sau đó được lọc để thu được hợp chất cần điều chế (9,13 g, 44,5 mmol).

Hiệu suất: định lượng

Đặc tính vật lý: điểm sôi $275-278^{\circ}\text{C}$

Ví dụ tham khảo sản xuất 7.

Sản xuất 4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit
công thức 13



Kali cacbonat (5,30 g, 38,1 mmol) và 3-fluoro-2-nitropyridin (2,00 g, 14,0 mmol) được bổ sung vào dung dịch axetonitril (65 mL) của 4-hydroxy-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit (2,60 g, 12,7 mmol), và được khuấy trong vòng 1 giờ dưới sự làm

nóng hồi lưu. Dung dịch phản ứng được lọc sử dụng Xelit ở trạng thái duy trì nhiệt làm nóng, và dịch lọc được cô bằng chân không. Tinh thể thu được được rửa bằng etyl axetat và sau đó được lọc để thu được hợp chất cần điều chế (2,60 g, 8,00 mmol).

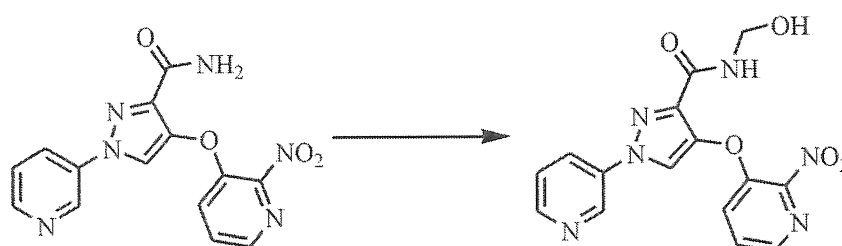
Hiệu suất: 63%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 179°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 8.

Sản xuất N-(hydroxymetyl)-4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit

công thức 14



Kali cacbonat (0,11 g, 0,80 mmol) và 37% focmalin (16 mL) được bổ sung vào dung dịch DMF (20 mL) của 4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit (2,60 g, 8,00 mmol), và được khuấy trong vòng 3,5 giờ ở nhiệt độ phòng. Nước (40 mL) được bổ sung vào dung dịch phản ứng và được khuấy trong vòng 5 phút. Tinh thể được sản xuất được lọc và sau đó được rửa bằng MTBE để thu được hợp chất cần điều chế (2,50 g, 7,00 mmol).

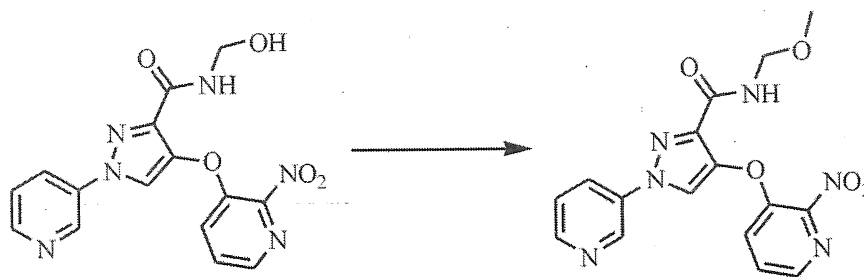
Hiệu suất: 87%

Đặc tính vật lý: điểm sôi 192°C

Ví dụ tham khảo sản xuất 9.

Sản xuất N-(metoxymetyl)-4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit

công thức 15



Axit oxalic (0,19 g, 2,07 mmol) được bổ sung vào dung dịch metanol (85 mL) của N-(hydroxymethyl)-4-((2-nitropyridin-3-yl)oxy)-1-(pyridin-3-yl)-1H-pyrazol-3-carboxamit (1,00 g, 2,80 mmol) cho đến khi độ pH của dung dịch đạt được ở mức quanh 3, và được khuấy trong vòng 5 giờ dưới sự làm nóng hồi lưu. Dung dịch phản ứng được quay trở lại nhiệt độ phòng và sau đó được cô bằng chân không để thu được hợp chất cần điều chế đóng vai trò là sản phẩm thô.

Đặc tính vật lý: điểm sôi 180°C

Ví dụ của các sản phẩm được thể hiện dưới đây; tuy nhiên, nên được lưu ý rằng các sản phẩm không bị giới hạn vào những ví dụ này. Trong Ví dụ sản phẩm "phần" đề cập đến "phần khối lượng."

Ví dụ sản phẩm 1.

Hợp chất theo sáng chế	10 phần
Xylen	70 phần
N-metylpyrrolidon	10 phần
Hỗn hợp của polyoxyetylen nonyl phenyl ete và canxi alkyl benzen sunfonat	10 phần

Các thành phần trên đây được trộn đồng nhất và được hòa tan, và chế biến thành nhũ tương.

Ví dụ sản phẩm 2.

Hợp chất theo sáng chế	3 phần
Bột đất sét	82 phần
Đất tảo cát bột	15 phần

Các thành phần trên đây được trộn đồng nhất và nghiền, và chế biến thành bột.

Ví dụ sản phẩm 3.

Hợp chất theo sáng chế	5 phần
------------------------	--------

Bột hỗn hợp của bentonit và đất sét 90 phần

Canxi lignin sunfonat 5 phần

Các thành phần trên đây được trộn đồng nhất và nhào trộn với lượng nước được bổ sung vào phù hợp, sau đó hỗn hợp được nhào trộn được tạo hạt và được làm khô, và được chế biến thành hạt.

Ví dụ sản phẩm 4.

Hợp chất theo sáng chế 20 phần

Caolan và axit silixic có độ phân tán cao tổng hợp 75 phần

Hỗn hợp của polyoxyetylen nonyl phenyl ete và canxi alkyl benzen sunfonat 5 phần

Các thành phần trên đây được trộn đồng nhất và nghiền, và làm thành bột có thể thấm ướt.

Ví dụ thử nghiệm 1.

Thử nghiệm hiệu quả kiểm soát trên rệp đào xanh (*Myzus Persicae*)

Bắp cải Trung Quốc được trồng trong chậu nhựa, mỗi chậu có kích thước đường kính bằng 8 cm và chiều cao 8 cm, sau đó rệp đào xanh được rắc và số côn trùng ký sinh được kiểm tra trong mỗi chậu. Hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được phân tán trong nước và sự phân tán được pha loãng đến 500 ppm ở dạng chất phản ứng, sau đó chất phản ứng được phun trên thân và lá của bắp cải Trung Quốc được đặt trong chậu và để khô trong gió, và các chậu được giữ trong nhà kính, và ở ngày thứ 6 sau khi chất phản ứng được phun, số rệp đào xanh sống ký sinh trên mỗi bắp cải Trung Quốc được kiểm tra và hiệu quả kiểm soát được tính theo công thức dưới đây, và sự đánh giá được thực hiện theo tiêu chuẩn dưới đây.

Công thức toán học 1

$$\text{Giá trị bảo vệ} = 100 - \{ (T/T_a) \times (C_a/C) \} \times 100$$

Ta: Số côn trùng ký sinh trong vùng xử lý trước khi phun

T: Số côn trùng ký sinh trong vùng xử lý sau khi phun

Ca: Số côn trùng ký sinh trong vùng không xử lý trước khi phun

C: Số côn trùng ký sinh trong vùng không xử lý sau khi phun

Tiêu chuẩn

A --- tỷ lệ kiểm soát: 100%

B --- tỷ lệ kiểm soát: 99% to 90%

C --- tỷ lệ kiểm soát: 89% to 80%

D --- tỷ lệ kiểm soát: 79% to 50%

Ví dụ thử nghiệm 2. Thử nghiệm Hiệu quả diệt côn trùng chống lại bọ nhảy cây trồng màu nâu nhỏ (*Laodelphax Striatellus*)

Hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được phân tán trong nước và sự phân tán được pha loãng đến 50 ppm ở dạng chất phản ứng, sau đó lúa được trồng từ hạt giống (giống: Nipponbare) được ngâm trong chất phản ứng trong vòng 30 giây và được làm khô trong gió, và sau đó được đặt trong ống thử nghiệm bằng thủy tinh, mỗi ống được cấy với 10 ấu trùng hình sao thứ ba của bọ nhảy cây trồng màu nâu nhỏ và bịt kín bằng bông, và 8 ngày sau khi cấy, số côn trùng sống và số côn trùng chết được kiểm tra và tỷ lệ chết của côn trùng được hiệu chỉnh được tính trên cơ sở của công thức dưới đây, và sự đánh giá được thực hiện theo tiêu chuẩn dưới đây.

Công thức toán học 2

$$\begin{array}{l} \text{Tỷ lệ chết của côn} \\ \text{trùng được hiệu} \end{array} \quad \begin{array}{l} \text{Tỷ lệ sống sót trong vùng không xử lý -} \\ \text{chỉnh} \end{array} \quad (\%) = \frac{\text{Tỷ lệ sống sót trong vùng xử lý}}{\text{Tỷ lệ sống sót trong vùng không xử lý}} \times 100$$

Tiêu chuẩn

A --- Tỷ lệ chết của côn trùng được hiệu chỉnh: 100%

B --- Tỷ lệ chết của côn trùng được hiệu chỉnh: 99% đến 90%

C --- Tỷ lệ chết của côn trùng được hiệu chỉnh: 89% đến 80%

D --- Tỷ lệ chết của côn trùng được hiệu chỉnh: 79% đến 50%

Ví dụ thử nghiệm 3. Thử nghiệm hiệu quả diệt côn trùng chống lại ruồi trắng (*Bemisia tabaci*)

Hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được phân tán trong nước và sự phân tán được pha loãng đến 500 ppm ở dạng

chất phản ứng, sau đó chất pha loãng được phun trên lá khoai tây thu được bằng cách cắt và sau đó được làm khô trong gió. Lá được cố định vào lọ sử dụng bông hấp thụ để bề mặt trước của lá hướng lên trên. Trong bình chứa này, 7 cặp ruồi trắng trưởng thành được cấy và sau đó được đặt dưới nhiệt độ phòng không đổi với nhiệt độ bằng 25°C và độ ẩm bằng 65%, và tỷ lệ diệt côn trùng được tính bằng cách kiểm tra sự sống sót hoặc chết của côn trùng 2 ngày sau khi cấy, và sự đánh giá được thực hiện theo tiêu chuẩn dưới đây. Thử nghiệm được lặp lại 2 lần.

Tiêu chuẩn

- A --- Tỷ lệ diệt côn trùng: 100%
- B --- Tỷ lệ diệt côn trùng: 99% đến 90%
- C --- Tỷ lệ diệt côn trùng: 89% đến 80%
- D --- Tỷ lệ diệt côn trùng: 79% đến 50%

Kết quả cho thấy rằng, trong Ví dụ thử nghiệm 1, hợp chất trong số các Hợp chất số 1-1 và 1-2 được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có hiệu quả trừ sâu tốt theo mức đánh giá A chống lại rệp đào xanh.

Hơn nữa, trong Ví dụ thử nghiệm 2, hợp chất trong số các Hợp chất số 1-1 và 1-2 được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có hiệu quả trừ sâu theo mức đánh giá A chống lại bọ nhảy cây trồng màu nâu nhỏ.

Hơn nữa, trong Ví dụ thử nghiệm 3, hợp chất trong số các Hợp chất số 1-1 và 1-2 được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có hiệu quả trừ sâu theo mức đánh giá A chống lại ruồi trắng.

Ví dụ thử nghiệm 4. Thử nghiệm sinh quái thai sử dụng phôi cá ngựa vằn

Trứng được thụ tinh thu được bằng cách cho giao phối cá ngựa vằn được cấy trong môi trường (0,3 × dung dịch Danieau) ở 28°C trong vòng 6 giờ sau khi cấy. Sau đó, phôi được chuyển sang môi trường mà hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được hòa tan trong dimetyl sulfoxit được bổ sung, và được cấy ở 28°C trong vòng 5 ngày. Nồng độ của dimetyl sulfoxit trong môi trường là 0,1%. 12 phôi được thử nghiệm trong mỗi nồng độ thử nghiệm theo sáng chế. 5 ngày sau khi cấy, sự sống sót hoặc chết của trứng và điều kiện áp được xác định dưới kính hiển vi lập thể, và

tính bất thường hình thái của các vị trí sau và đặc tính bơi được quan sát đối với những con sống sót.

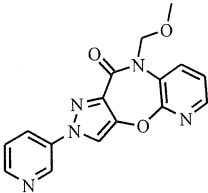
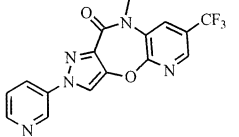
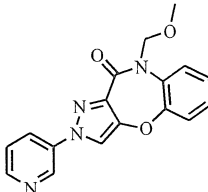
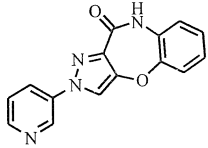
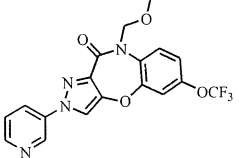
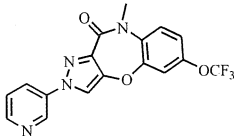
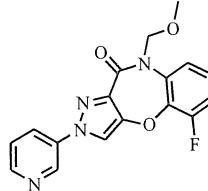
Vị trí quan sát: nguyên sống, đuôi, đốt, mắt, sỏi tai, hàm, tim, mạch máu, bụng, vây, v.v..

Từ kết quả của những quan sát này, sự có mặt hoặc vắng mặt của nguy cơ sinh quái thai của hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế và 6 hợp chất (Hợp chất số 4-10, 1-67, 1-1, 8-125, và 8-22, và hợp chất được bộc lộ qua yêu cầu bảo hộ của Tài liệu sáng chế 1 (Hợp chất so sánh 4)) được bộc lộ trong Tài liệu sáng chế 1 nêu trên đây làm hợp chất so sánh được xác định.

Kết quả được thể hiện trong Bảng 2 dưới đây.

Lưu ý rằng thử nghiệm sinh quái thai sử dụng phôi cá ngựa vằn được biết đến có khả năng dự đoán tốt đối với thử nghiệm sinh quái thai sử dụng động vật có vú (Tài liệu tham khảo: Reproductive Toxicology 2012, (33), 155-164).

Bảng 2

Hợp chất	Cấu trúc	Nguy cơ sinh quái thai
1-1		Không
Hợp chất so sánh 1 (Hợp chất số 4-10 của Tài liệu sáng chế 1)		Có
Hợp chất so sánh 2 (Hợp chất số 1-67 của Tài liệu sáng chế 1)		Có
Hợp chất so sánh 3 (Hợp chất số 1-1 của Tài liệu sáng chế 1)		Có
Hợp chất so sánh 4 (Hợp chất được bảo hàm bởi yêu cầu bảo hộ của Tài liệu sáng chế 1)		Có
Hợp chất so sánh 5 (Hợp chất số 8-125 của Tài liệu sáng chế 1)		Có
Hợp chất so sánh 6 (Hợp chất số 8-22 của Tài liệu sáng chế 1)		Có

Như được thể hiện trong Bảng 2, trong số các nhóm hợp chất có xương sống cơ sở tương tự, hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế được xác

định không có nguy cơ sinh quái thai trong thử nghiệm sinh quái thai sử dụng phôi cá ngựa vằn.

Vì thử nghiệm sinh quái thai sử dụng phôi cá ngựa vằn là kỹ thuật được biết đến có khả năng dự đoán cao đối với thử nghiệm sinh quái thai sử dụng động vật có vú như được mô tả trên đây, đã thấy từ kết quả thử nghiệm trên đây rằng hợp chất được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế là nhóm hợp chất giảm bớt được ảnh hưởng có hại cho động vật bao gồm con người.

Khả năng áp dụng công nghiệp

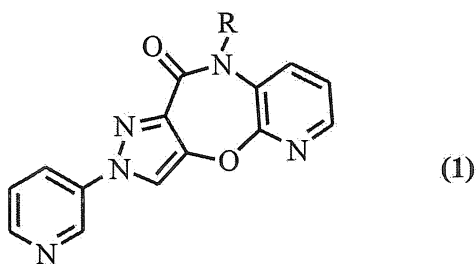
Hợp chất hoặc muối của chúng như được đề xuất theo sáng chế là rất có ích trên phương diện hiệu quả tốt làm thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn và ảnh hưởng có hại được giảm bớt cho động vật bao gồm con người.

Hiệu quả đạt được theo sáng chế

Hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) như được đề xuất theo sáng chế có hiệu quả tốt làm thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn. Nó cũng có hiệu quả đối với côn trùng gây hại mà sống trên chó, mèo, và thú cưng khác, hoặc bò, cừu, và gia súc khác. Hơn nữa, hợp chất hoặc muối của chúng được thể hiện bằng Công thức chung (1) theo sáng chế có ít tác động có hại đến động vật bao gồm con người, và như vậy rất hữu ích làm thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn mới.

Yêu cầu bảo hộ

1. Hợp chất, hoặc muối của chúng, được thể hiện bằng Công thức chung (1):
công thức 1



{trong công thức này, R là nhóm metoxymetyl}.

2. Thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn trong đó thuốc này chứa hợp chất hoặc muối của chúng theo điểm 1, đóng vai trò là thành phần hoạt tính.
3. Phương pháp sử dụng thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn, khác biệt ở chỗ thuốc trừ sâu nông nghiệp/nghề làm vườn theo điểm 2 được áp dụng cho cây trồng hoặc đất với lượng hiệu quả.