



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ

(11)



1-0050454

A61P 33/10; A01N 43/90; A01P 7/02; (13) B

(51)^{2016.01} A01P 7/04; C07D 471/04; A61K
31/4439; A61K 31/444; C07D 413/14;
A01N 43/836; A01P 9/00

(21) 1-2022-01005

(22) 11/09/2020

(86) PCT/JP2020/034387 11/09/2020

(87) WO2021/049595 18/03/2021

(30) 2019-165792 12/09/2019 JP

(45) 25/08/2025 449

(43) 25/05/2022 410A

(73) NIHON NOHYAKU CO., LTD. (JP)

19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386, JAPAN

(72) YAMAUCHI, Chiaki (JP); YONEMURA, Ikki (JP); FUJIHARA, Hirokazu (JP).

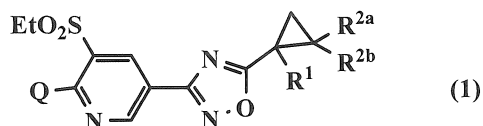
(74) Công ty Cổ phần Sở hữu công nghiệp INVESTIP (INVESTIP)

(54) THUỐC TRỪ SÂU DÙNG TRONG NÔNG NGHIỆP HOẶC TRỒNG TRỌT
HOẶC CHẤT PHÒNG TRỪ VẬT KÝ SINH NGOÀI HOẶC VẬT KÝ SINH
NGOÀI ĐỘNG VẬT CHỨA HỢP CHẤT DỊ VÒNG NGỪNG TỤ CÓ NHÓM
XYCLOPROPAN-OXADIAZOL ĐƯỢC THỂ HOẶC MUỐI CỦA CHÚNG LÀM
THÀNH PHẦN HOẠT TÍNH, VÀ PHƯƠNG PHÁP SỬ DỤNG THUỐC TRỪ SÂU
HOẶC CHẤT PHÒNG TRỪ

(21) 1-2022-01005

(57) Trong sản xuất cây trồng thuộc các lĩnh vực nông nghiệp, trồng trọt và các lĩnh vực tương tự, thiệt hại do côn trùng gây ra vẫn còn rất lớn, và côn trùng có khả năng kháng các loại thuốc trừ sâu hiện có đã xuất hiện. Sáng chế đề cập đến dựa trên những trường hợp như vậy, và mục đích của sáng chế là phát triển và cung cấp loại thuốc trừ sâu mới cho nông nghiệp hoặc trồng trọt. Mục đích khác của sáng chế là đề xuất chất có khả năng loại bỏ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh của động vật. Mục đích sáng chế đạt được nhờ hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1):

Công thức hóa học 1



(trong đó R^1 tốt hơn là là nhóm alkyl, R^{2a} và R^{2b} mỗi nhóm tốt hơn là là nguyên tử hydro, R^3 tốt hơn là nhóm haloalkyl, và Q tốt hơn là imidazo [4,5-b] pyridin) hoặc muối của chúng, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt hoặc chất phòng trừ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh, mỗi chất bao gồm hợp chất hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính, và phương pháp sử dụng hợp chất hoặc muối của chúng, thuốc trừ sâu, hoặc chất phòng trừ.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt hoặc chất phòng trừ vật ký sinh ngoài hoặc vật ký sinh ngoài động vật mà mỗi thuốc trừ sâu hoặc chất phòng trừ chứa hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính, và phương pháp để sử dụng thuốc trừ sâu hoặc chất phòng trừ.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các hợp chất khác nhau đã được nghiên cứu về khả năng làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt, và trong số chúng, các loại hợp chất dị vòng ngưng tụ nhất định đã được báo cáo là hữu ích làm thuốc trừ sâu (ví dụ, xem Tài liệu sáng chế từ 1 đến 4). Tuy nhiên, các tài liệu không bộc lộ cụ thể các loại hợp chất dị vòng ngưng tụ nhất định có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thế.

Danh sách tài liệu trích dẫn**Tài liệu sáng chế**

Tài liệu sáng chế 1: WO 2014/142292

Tài liệu sáng chế 2: WO 2016/104746

Tài liệu sáng chế 3: WO 2017/065183

Tài liệu sáng chế 4: WO 2017/146221

Bản chất kỹ thuật của sáng chế**Vấn đề kỹ thuật**

Trong sản xuất cây trồng thuộc lĩnh vực nông nghiệp, trồng trọt và các lĩnh vực tương tự, thiệt hại do côn trùng gây hại ... vẫn còn rất lớn. Giải quyết vấn đề này đòi hỏi các loại thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt có hiệu quả trong việc kiểm soát côn trùng gây hại kháng thuốc mới xuất hiện với tác động hạn chế đến các chất chỉ thị sinh học, tiết kiệm lao động vận hành, đảm bảo an toàn cho người vận hành, v.v.; và chúng cũng có đặc điểm là ít tác động đến các sinh vật không đích như động vật ăn thịt tự nhiên và côn trùng có ích; hoạt động như thuốc trừ sâu có hệ thống; có độc tính thấp đối với động vật có vú kể cả con người; ít ảnh hưởng đến các chất chỉ thị sinh học như cá và chim; có tác dụng tương tự trên các loài khác nhau; có khả năng phân hủy môi trường; và tương tự. Do đó, mong muốn phát triển thuốc trừ sâu dùng cho nông nghiệp hoặc trồng trọt mới có các đặc tính ưu việt như vậy. Ngoài ra, cũng mong muốn phát triển các chất mới có khả năng phòng trừ ký sinh trong động vật và ký sinh trong.

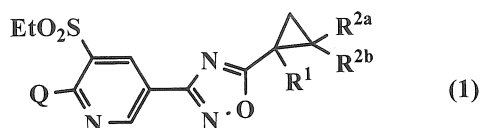
Giải quyết vấn đề

Các tác giả sáng chế đã thực hiện nghiên cứu chuyên sâu để giải quyết các vấn đề nêu trên. Do đó, các tác giả sáng chế đã phát hiện ra rằng hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) hoặc muối của chúng có hiệu quả cao trong việc phòng trừ sâu bệnh gây hại trong nông nghiệp hoặc trồng trọt. Hơn nữa, các tác giả sáng chế cũng đã phát hiện ra rằng hợp chất hoặc muối của chúng hầu như không có tác động đến các sinh vật không đích như động vật ăn thịt tự nhiên và côn trùng có ích, mà là hợp chất hữu hiệu với khả năng phân hủy môi trường, và mà có thể phòng trừ các vật ký sinh ngoài động vật và vật ký sinh ngoài. Dựa trên các phát hiện này, sáng chế được thực hiện thêm rất nhiều các nghiên cứu kiểm tra và hoàn thành sáng chế.

Có nghĩa là, sáng chế bao gồm như sau.

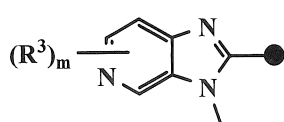
[1] Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1):

Công thức hóa học 1

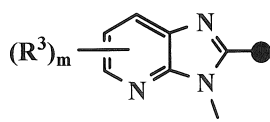


(trong đó R^1 , R^{2a} , và R^{2b} có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi loại biểu diễn (a1) nguyên tử hydro; (a2) nguyên tử halogen; (a2) nhóm xyano; (a3) nhóm (C_1 - C_6) alkyl; (a4) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; hoặc (a5) nhóm phenyl, Et là nhóm ethyl (sau đây áp dụng tương tự), và Q là nhóm bất kỳ trong số các nhóm được biểu diễn bởi từ Q-1 đến Q-3 sau đây:

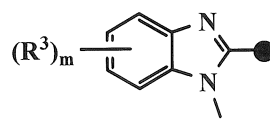
Công thức hóa học 2



Q-1



Q-2



Q-3

trong đó R^3 là (b1) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; (b2) nhóm halo (C_1 - C_6) alkoxy; (b3) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylthio; (b4) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfinyl; hoặc (b5) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfonyl, mỗi vòng được tô đặc màu đen là vị trí liên kết, và m là 1 hoặc 2), hoặc muối của chúng.

[2] Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo mục nêu trên [1], trong đó R^1 là (a3) nhóm (C_1 - C_6) alkyl; (a4) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; hoặc (a5) nhóm phenyl, R^{2a} và R^{2b} là (a1) các nguyên tử hydrogen, và R^3 là (b1) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl.

[3] Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo mục [1] hoặc [2] nêu trên, trong đó Q là Q-2.

[4] Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên làm thành phần hoạt tính.

[5] Phương pháp để sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt, bao gồm bước xử lý thực vật hoặc đất với lượng hữu hiệu hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3].

[6] Chất phòng trừ vật ký sinh ngoài hoặc vật ký sinh ngoài động vật bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thế hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên làm thành phần hoạt tính.

[7] Phương pháp để sử dụng chất phòng trừ vật ký sinh ngoài hoặc vật ký sinh ngoài động vật, bao gồm việc dùng cho động vật qua da hoặc qua đường miệng lượng hữu hiệu hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thế hoặc muối của chúng theo mục bất kỳ trong số các mục từ [1] đến [3] nêu trên.

Hiệu quả đạt được của sáng chế

Hợp chất theo sáng chế hoặc muối của chúng không chỉ có hiệu quả cao làm thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt mà còn có hiệu quả đối với việc diệt trừ các loại vật mà sống bên trong hoặc bên ngoài các vật nuôi trong nhà như chó và mèo và các động vật nuôi như gia súc và cừu, và đối với việc diệt trừ các loài gây hại khác như mối.

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong các định nghĩa của công thức chung (1) là hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thế theo sáng chế hoặc muối của chúng, "halo" dùng để chỉ "nguyên tử halogen" và là nguyên tử clo, nguyên tử brom, nguyên tử iốt hoặc nguyên tử flo.

“Nhóm (C₁-C₆) alkyl” là nhóm alkyl mạch thẳng hoặc nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm isopropyl, nhóm n-butyl, nhóm isobutyl, nhóm sec-butyl, nhóm tert-butyl, nhóm n-pentyl, nhóm isopentyl, nhóm tert-pentyl, nhóm neopentyl, nhóm 2,3-dimethylpropyl, nhóm 1-ethylpropyl, nhóm 1-methylbutyl, nhóm 2-methylbutyl, nhóm n-hexyl, nhóm isohexyl, nhóm 2-hexyl, nhóm 3-hexyl, nhóm 2-methylpentyl, nhóm 3-methylpentyl, nhóm 1,1,2-trimethyl propyl, nhóm 3,3-dimethylbutyl hoặc tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkoxy” là nhóm alkoxy mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm isopropoxy, nhóm n-butoxy, nhóm sec-butoxy, nhóm tert-butoxy, nhóm n-pentyloxy, nhóm isopentyloxy, nhóm tert-pentyloxy, nhóm neopentyloxy, nhóm

2,3-dimethylpropyloxy, nhóm 1-ethylpropyloxy, nhóm 1-methylbutyloxy, nhóm n-hexyloxy, nhóm isohexyloxy, nhóm 1,1,2-trimethylpropyloxy hoặc tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkylthio” là nhóm alkylthio mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ: nhóm methylthio, nhóm ethylthio, nhóm n-propylthio, nhóm isopropylthio, nhóm n-butylthio, nhóm sec-butylthio, nhóm tert-butylthio, nhóm n-pentylthio, nhóm isopentylthio, nhóm tert-pentylthio, nhóm neopentylthio, nhóm 2,3-dimethylpropylthio, nhóm 1-ethylpropylthio, 1-methylbutylthio nhóm, nhóm n-hexylthio, nhóm isohexylthio, nhóm 1,1,2-trimethylpropylthio hoặc tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl” là nhóm alkylsulfinyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylsulfinyl, nhóm ethylsulfinyl, nhóm n-propylsulfinyl, nhóm isopropylsulfinyl, nhóm n-butylsulfinyl, nhóm sec-butylsulfinyl, nhóm tert-butylsulfinyl, nhóm n-pentylsulfinyl, nhóm isopentylsulfinyl, nhóm tert-pentylsulfinyl, nhóm neopentylsulfinyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfinyl, nhóm 1-ethylpropylsulfinyl, nhóm 1-methylbutylsulfinyl, nhóm n-hexylsulfinyl, nhóm isohexylsulfinyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfinyl hoặc tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl” là nhóm alkylsulfonyl mạch thẳng hoặc mạch nhánh có từ 1 đến 6 nguyên tử cacbon, ví dụ, nhóm methylsulfonyl, nhóm ethylsulfonyl, nhóm n-propylsulfonyl, nhóm isopropylsulfonyl, nhóm n-butylsulfonyl, nhóm sec-butylsulfonyl, nhóm tert-butylsulfonyl, nhóm n-pentylsulfonyl, nhóm isopentylsulfonyl, nhóm tert-pentylsulfonyl, nhóm neopentylsulfonyl, nhóm 2,3-dimethylpropylsulfonyl, nhóm 1-ethylpropylsulfonyl, nhóm 1-methylbutylsulfonyl, nhóm n-hexylsulfonyl, nhóm isohexylsulfonyl, nhóm 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl hoặc tương tự.

“Nhóm (C₁-C₆) alkyl”, “nhóm (C₁-C₆) alkoxy”, “nhóm (C₁-C₆) alkylthio”, “nhóm (C₁-C₆) alkylsulfinyl”, và “nhóm (C₁-C₆) alkylsulfonyl” nêu trên có thể được thế bởi một hoặc nhiều nguyên tử halogen ở (các) vị trí thế, và trong trường hợp mà có nhóm bất kỳ trong số các nhóm nêu trên được thế bởi hai hoặc nhiều nguyên tử halogen, các nguyên tử halogen có thể giống nhau hoặc khác nhau.

Các nhóm được đề cập ở trên được thế bởi một hoặc nhiều nguyên tử halogen được biểu thị dưới dạng “nhóm halo (C₁-C₆) alkyl”, “nhóm halo (C₁-C₆) alkoxy”,

“nhóm halo (C₁-C₆) alkylthio”, “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfinyl”, và “nhóm halo (C₁-C₆) alkylsulfonyl”. Các định nghĩa và ví dụ của mỗi nhóm theo sáng chế đều là hiển nhiên đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này.

Biểu thức “(C₁-C₆)” là phạm vi số nguyên tử cacbon trong mỗi nhóm.

Ví dụ về muối của hợp chất có công thức chung (1) theo sáng chế bao gồm các muối axit vô cơ, chẳng hạn như hydroclorua, sunfat, nitrat và photphat; muối axit hữu cơ, chẳng hạn như axetat, fumarate, maleat, oxalat, metanesulfonat, benzensulfonat và p-toluensulfonat; và muối có gốc vô cơ hoặc hữu cơ như ion natri, ion kali, ion canxi và ion trimetylamonium. Muối bất kỳ có thể được sử dụng miễn là nó được chấp nhận như chất diệt trừ sâu bệnh như hóa chất dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt hoặc thuốc thú y.

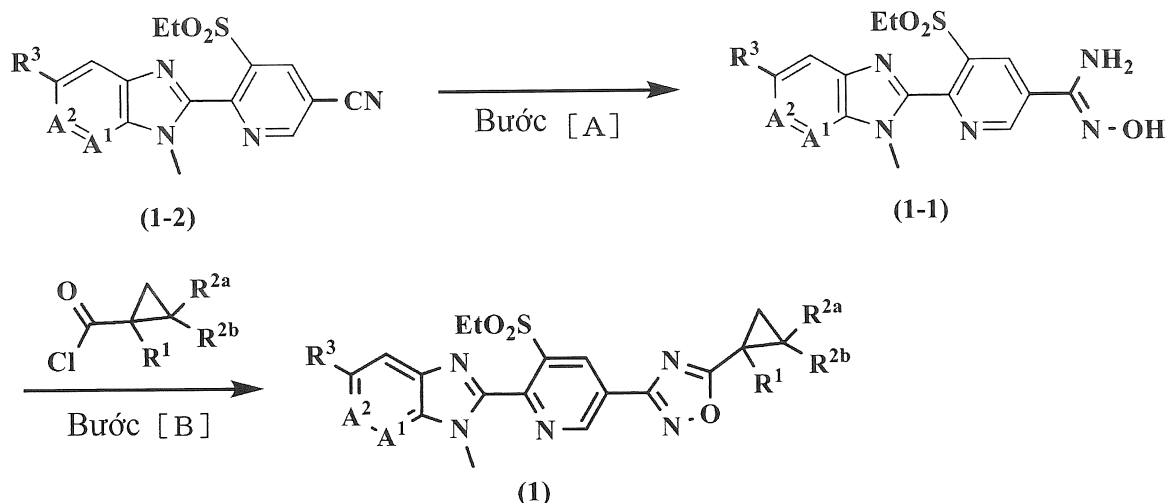
Hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế và muối của chúng có thể có một hoặc nhiều tâm bất đối xứng trong công thức cấu tạo và có thể tồn tại ở hai hoặc nhiều loại đồng phân quang học. Tất cả các đồng phân quang học và hỗn hợp của các đồng phân theo tỷ lệ bất kỳ cũng được bao gồm trong sáng chế.

Trong hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng, R¹ tốt hơn là (a3) nhóm (C₁-C₆) ankyl, (a4) nhóm halo (C₁-C₆) ankyl, hoặc (a5) nhóm phenyl, R^{2a} và R^{2b} tốt hơn là (a1) nguyên tử hydro, và R³ tốt hơn là (b1) nhóm (C₁-C₆) ankyl. Theo phương án tốt hơn là, R¹ là (a3) nhóm (C₁-C₆) ankyl, (a4) nhóm halo (C₁-C₆) ankyl, hoặc (a5) nhóm phenyl, R^{2a} và R^{2b} là (a1) nguyên tử hydro, R³ là (b1) nhóm (C₁-C₆) ankyl, và Q là imidazo [4,5-b] pyridin.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể theo sáng chế hoặc muối của chúng có thể được sản xuất theo, ví dụ, theo phương pháp được mô tả trong WO 2017/146221 hoặc phương pháp sản xuất được mô tả dưới đây, là ví dụ không giới hạn. Các hợp chất trung gian được sử dụng trong phương pháp sản xuất theo sáng chế có thể là các sản phẩm có sẵn trên thị trường như chúng vốn có, hoặc chúng có thể được tạo ra từ các sản phẩm có sẵn trên thị trường bằng các phương pháp đã biết.

Phương pháp sản xuất 1

Công thức hóa học 3



Trong công thức (1), R^1 , R^{2a} , R^{2b} , và R^3 giống như nêu trên

A^1 và A^2 có thể giống hoặc khác nhau và mỗi nhóm là nhóm N hoặc CH, trừ trường hợp cả hai đều là Ns

Phương pháp sản xuất ở bước [A]

Hợp chất amidoxim có công thức chung (1-1) có thể được tạo ra bằng cách cho hợp chất nitril có công thức chung (1-2) phản ứng với hydroxylamin khi có mặt của bazơ và dung môi trơ.

Ví dụ về bazơ được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; amin bậc ba như trietylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimetylaminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (1-2).

Ví dụ về hydroxylamin được sử dụng trong phản ứng này bao gồm hydroxylamin hydroclorua và hydroxylamin sulfat.

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ngăn một cách rõ rệt sự tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetracolorua; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete (MTBE), dioxan và tetrahydrofuran; este như etyl axetat; amit như

dimethylformamit và dimethylaxetamit; xeton như axeton và metyl etyl xeton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit, 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và nước. Một trong các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp.

Vì phản ứng này là phản ứng đẳng mol của các chất phản ứng, về cơ bản chúng được sử dụng với lượng bằng nhau, nhưng một trong số chúng có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng có thể nằm trong khoảng nhiệt độ phòng đến nhiệt độ sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo thang phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản là trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng kết thúc, hợp chất quan tâm được phân lập khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, có thể sử dụng tái kết tinh, sắc ký cột, v.v. để tinh chế hợp chất quan tâm.

Phương pháp sản xuất ở bước [B]

Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể theo công thức chung (1) có thể được tạo ra bằng cách cho hợp chất amidoxim có công thức chung (1-1) phản ứng với axit cacboxylic clorua hoặc anhydrit cacboxylic tương ứng, v.v. trong sự hiện diện của bazơ và dung môi trơ.

Ví dụ về bazơ được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; amin bậc ba như trietylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimetylaminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (1-1).

Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ mà không ngăn một cách rõ rệt sự tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete (MTBE), dioxan và tetrahydrofuran; este như etyl axetat; amit như

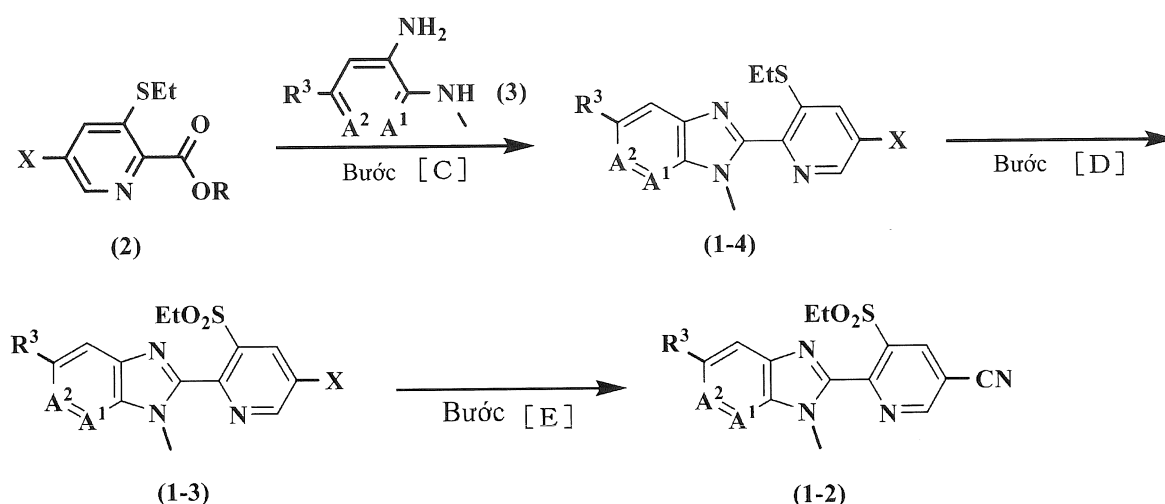
dimethylformamit và dimethylaxetamit; xeton như axeton và metyl etyl xeton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Một trong các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp.

Nhiệt độ phản ứng nằm trong khoảng nhiệt độ phòng (10 đến 40°C) đến nhiệt độ sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo thang phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản là trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ.

Sau khi phản ứng kết thúc, hợp chất quan tâm được phân lập khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, có thể sử dụng tái kết tinh, sắc ký cột, v.v. để tinh chế hợp chất quan tâm.

Phương pháp sản xuất hợp chất ban đầu (1-2)

Công thức hóa học 4



Trong công thức, R³ giống như trên, X là nguyên tử halogen, và R là nhóm C₁-C₃ alkyl.

A¹ và A² có thể giống hoặc khác nhau và mỗi nhóm là N hoặc nhóm CH, trừ trường hợp cả hai là Ns.

Phương pháp sản xuất ở bước [C]

Este của axit cacboxylic có công thức chung (2), được sản xuất theo phương pháp được mô tả trong WO 2016/121997, được phản ứng với hợp chất pyridin hoặc benzen được biểu diễn theo công thức chung (3), được sản xuất theo phương pháp được mô tả trong WO 2014/142292, với sự có mặt của bazơ và dung môi trơ để tạo ra chất trung gian amit. Chất trung gian, được phân lập tùy ý, được tuần hoàn trong điều kiện axit để tạo ra hợp chất imidazopyridin hoặc benzimidazol được biểu diễn bởi công thức chung (1-4).

Ví dụ về bazơ được sử dụng trong quá trình tuần hoàn này bao gồm các bazơ vô cơ như natri hydroxit, kali hydroxit, natri cacbonat, kali cacbonat, natri hydro cacbonat và kali hydro cacbonat; axetat như natri axetat và kali axetat; các alkoxit kim loại kiềm như kali t-butoxit, natri metoxit và natri etoxit; amin bậc ba như trietylamin, diisopropyletylamin và 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en; và các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin và dimetylaminopyridin. Lượng bazơ được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (2).

Dung môi trơ được sử dụng trong quá trình tuần hoàn này có thể là dung môi bất kỳ mà không ngăn một cách rõ rệt sự tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylene; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetrachlorua; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete (MTBE), dioxan và tetrahydrofuran; este như etyl axetat; amit như dimetylformamit và dimetylaxetamit; xeton như axeton và metyl etyl xeton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Một trong các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp.

Vì quá trình tuần hoàn này là phản ứng đẳng mol của các chất phản ứng, về cơ bản chúng được sử dụng với lượng bằng nhau, nhưng một trong số chúng có thể được sử dụng với lượng dư. Nhiệt độ phản ứng có thể nằm trong khoảng nhiệt độ phòng đến nhiệt độ sôi của dung môi trơ được sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo thang phản ứng và nhiệt độ phản ứng, nhưng về cơ bản là trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng hoàn thành, chất trung gian thu được, được phân lập tùy ý từ hỗn hợp sau phản ứng, được phản ứng với sự có mặt của axit và dung môi trơ để tạo ra chất trung gian amit.

Ví dụ về axit được sử dụng trong quá trình tuần hoàn này bao gồm các axit vô cơ như axit clohydric, axit sulfuric và axit nitric; axit hữu cơ như axit fomic, axit axetic, axit propionic, axit trifloaxetic và axit benzoic; axit sulfonic như axit metansulfonic và axit triflometansulfonic; và axit photphoric. Lượng axit được sử dụng được chọn sao

cho thích hợp trong khoảng từ 0,01 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (2).

Dung môi trợ được sử dụng trong quá trình tuần hoàn này có thể là dung môi bất kỳ mà không ngăn một cách rõ rệt sự tiến triển của phản ứng, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, metyl tert-butyl ete (MTBE), dioxan và tetrahydrofuran; este như etyl axetat; amit như dimetylformamit và dimetylaxetamit; xeton như axeton và metyl etyl xeton; và các dung môi phân cực như dimetyl sulfoxit và 1,3-dimetyl-2-imidazolidinon. Một trong các dung môi trợ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp. Sau khi phản ứng kết thúc, hợp chất quan tâm được phân lập khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, có thể sử dụng tái kết tinh, sắc ký cột, v.v. để tinh chế hợp chất quan tâm.

Phương pháp sản xuất ở bước [D]

Hợp chất imidazopyridin hoặc benzimidazol được biểu diễn theo công thức chung (1-3) có thể được tạo ra bằng cách cho imidazopyridin hoặc hợp chất benzimidazol được biểu diễn theo công thức chung (1-4) phản ứng với chất oxy hóa trong dung môi trợ.

Ví dụ về chất oxy hóa được sử dụng trong phản ứng này bao gồm các peroxit như dung dịch hydro peroxyt, axit peroxybenzoic và axit m-cloperoxybenzoic. Lượng chất oxy hóa được sử dụng được lựa chọn một cách thích hợp trong khoảng từ 1 đến 10 lần lượng mol so với hợp chất imidazopyridin hoặc benzimidazol được biểu diễn bởi công thức chung (1-4).

Dung môi trợ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ không ức chế phản ứng một cách rõ rệt, và ví dụ bao gồm các ete mạch thẳng hoặc mạch vòng như dietyl ete, tetrahydrofuran và dioxan; hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; nitril như axetonitril; este như etyl axetat; axit hữu cơ như axit fomic và axit axetic; và các dung môi phân cực như N, N-dimetylformamit, N, N-dimetylaxetamit,

1,3-dimetyl-2-imidazolidinon và nước. Một trong các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp.

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này được chọn thích hợp trong khoảng -10°C đến nhiệt độ hồi lưu của dung môi trơ đã sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo quy mô phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự và không giống nhau trong mọi trường hợp, nhưng về cơ bản được chọn sao cho thích hợp trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Sau khi phản ứng kết thúc, hợp chất quan tâm được phân lập khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, có thể sử dụng tái kết tinh, sắc ký cột, v.v. để tinh chế hợp chất quan tâm.

Phương pháp sản xuất ở bước [E]

Hợp chất imidazopyridin hoặc benzimidazol được biểu diễn bởi công thức chung (1-2) có thể được tạo ra bởi được gọi là phản ứng Rosenmund-von Braun (Ber. Dtsch. Chem. Ges. 1919, 52, 1749) của imidazopyridazin được biểu diễn bởi công thức (1-3) với xyanua trong sự có mặt của dung môi trơ.

Ví dụ về xyanua có thể được sử dụng trong phản ứng này bao gồm natri xyanua, kali xyanua, kẽm xyanua và đồng xyanua.

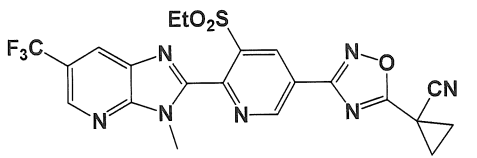
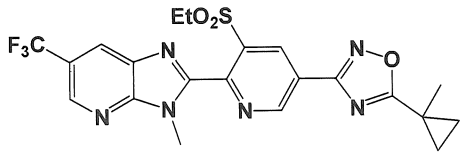
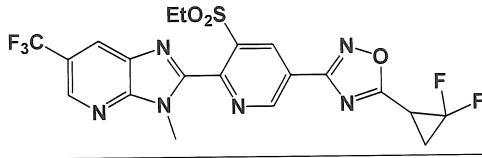
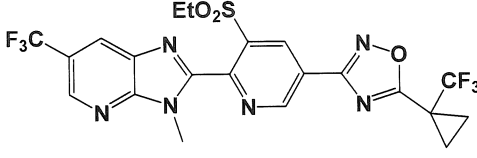
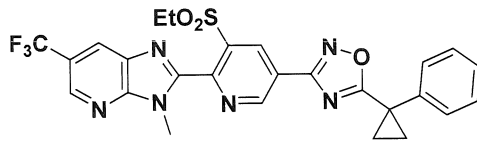
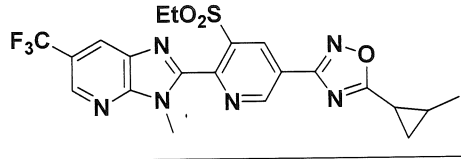
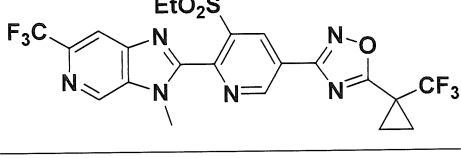
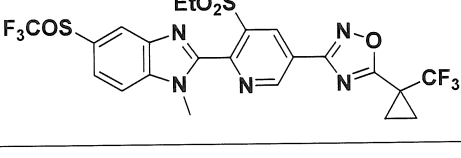
Dung môi trơ được sử dụng trong phản ứng này có thể là dung môi bất kỳ không ức chế phản ứng một cách rõ rệt, và các ví dụ bao gồm các hydrocacbon thơm như benzen, toluen và xylen; hydrocacbon béo halogen hóa như metylen clorua, cloform và cacbon tetraclorea; hydrocacbon thơm halogen hóa như clobenzen và diclobenzen; và dị vòng thơm như pyridin. Một trong các dung môi trơ này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều dung môi làm hỗn hợp.

Nhiệt độ phản ứng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng 0°C đến nhiệt độ sôi của dung môi đã sử dụng. Thời gian phản ứng thay đổi theo thang phản ứng, nhiệt độ phản ứng và tương tự, nhưng về cơ bản được chọn sao cho thích hợp trong khoảng từ vài phút đến 48 giờ. Lượng xyanua được sử dụng trong phản ứng này thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5 lần lượng mol so với hợp chất imidazopyridin hoặc benzimidazol được biểu diễn bởi công thức chung (1-3). Sau khi phản ứng kết thúc, hợp chất quan tâm được phân lập khỏi hỗn hợp sau phản ứng bằng phương pháp thông thường. Khi cần, có thể sử dụng tái kết tinh, sắc ký cột, v.v. để tinh chế hợp chất quan tâm.

Các ví dụ cụ thể về hợp chất theo sáng chế được trình bày dưới đây. Được thể hiện trong cột "Giá trị đặc tính vật lý" là điểm nóng chảy (°C).

[Bảng 1]

Bảng 1

Số hợp chất	Cấu tạo	Trị số đặc tính vật lý
1-1		
1-2		144-145
1-3		
1-4		151-152
1-5		176-178
1-6		150-151
1-7		177-179
1-8		140-141

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính thích hợp để kiểm soát nhiều loại gây hại mà có thể gây hại lúa, cây ăn quả, rau, cây trồng khác và cây cảnh có hoa. Các loài gây hại nhắm đích là, ví dụ, loài gây hại trong nông nghiệp và rừng, loài gây hại trong trồng trọt, loài gây hại hạt lưu trữ, loài gây hại vệ sinh, giun tròn, v.v.

Các ví dụ cụ thể bao gồm sau đây:

các loài thuộc bộ Lepidoptera chẳng hạn như *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapularis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tina translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *Trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *xystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaxeana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinnsis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *xydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophera batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tinola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *xydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella kêmkenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita*

molesta, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, các loài thuộc họ Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinreipalpana*, *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthopplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, các loài thuộc họ Pieridae như *Pieris brassicae* và *Pieris rapae crucivora*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* và *Earias cupreoviridis*;

các loài thuộc bộ Hemiptera như *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolinatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptopsaltria nigrofusca*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaaulacaspis prunicola*, *Axyrthosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeturodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza*

camphorae, *Leptocorisa chinnsis*, *Trioza quercicola*, *Uhlerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticiellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geoica lucifuga*, *Numata muii*, *Comstockaspis pernicioso*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigradorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis glycins*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanum*, *xyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris linolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlerites debile*, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovicia punctata*, *Empoasca* spp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus disponis*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginlla citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara*

viridula, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraecola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishidai*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* và *Aphis gossypii*;

các loài thuộc bộ Coleoptera như *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinnsis*, *xylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tunebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotha hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlinata*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nemuphar*, *Ceuthorhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilinata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linnaeidea aenea* và *Anthonomus grandis*;

các loài thuộc bộ Diptera như *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyosxyami*, *Liriomyza*

huidobrensis, *Musca domestica*, *clops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, các loài thuộc họ Phoridae như *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinnsis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* Forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinnsis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromiza nigriventris*, *Anastrepha ludens* và *Rhagoletis pomonella*;

các loài thuộc bộ Hymenoptera như *Pristomyrmex pungens*, Betylid wasps, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, Vespidae wasps, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* và *Ochetellus glaber*;

các loài thuộc bộ Orthoptera như *Homorocoryphus linosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* và *Teleogryllus emma*;

các loài thuộc bộ Thysanoptera như *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* và *Liothrips vaneeckei*;

các loài thuộc bộ Acari như *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, các loài thuộc họ Ixodidae như

Rhipicephalus sanguineus, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanensis*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvairum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptrehyssnus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculus schlehtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* và *Sancassania* sp.;

các loài thuộc bộ Isoptera như *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guangzhouensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* và *Reticulitermes speratus*;

các loài thuộc bộ Blattodea như *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* và *Periplaneta americana*;

các loài thuộc bộ Siphonaptera như *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* và *Ceratophyllus gallinae*;

các loài thuộc ngành Nematoda như *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* và *Tylenchus semipenetrans*; và

các loài thuộc ngành Mollusca như *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* và *Acusta despecta sieboldiana*.

Ngoài ra, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế đồng thời có tác dụng diệt côn trùng mạnh đối với *Tuta absoluta*.

Ngoài ra, các loài ve và bọ ve ký sinh ở động vật sống ở bên trong hoặc bên ngoài của động vật cũng được bao gồm trong các loài gây hại nhắm đích, và các ví dụ bao

gồm các loài thuộc họ Ixodidae như *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinoza*, *Dermacentor reticulatus* và *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; các loài của gen *Ornithonyssus* như *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bursa*; các loài thuộc họ Trombiculidae như *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* và *Helenicula miyagawai*; các loài thuộc họ Cheyletidae như *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* và *Cheyletiella blakei*; các loài thuộc siêu họ Sarcoptoidea như *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* và *Notoedres cati*; và các loài thuộc họ Demodicidae như *Demodex canis*.

Các loài gây hại khác bao gồm bộ chét bao gồm côn trùng không cánh ký sinh thuộc bộ Siphonaptera, cụ thể hơn là các loài thuộc họ Pulicidae và Ceratophyllidae. Các ví dụ về các loài thuộc họ Pulicidae bao gồm *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* và *Monopsyllus anisus*.

Các loài gây hại mục tiêu khác bao gồm ngoại ký sinh, ví dụ, các loài thuộc phân bộ Anoplura như *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* và *Pediculus capitis*; các loài thuộc phân bộ Mallophaga như *Trichodectes canis*; và các loài côn trùng gây hại thuộc nhóm Dipteran hematophagous như *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* và *Simulium ornatum*. Cũng bao gồm các vật ký sinh ngoài, ví dụ, giun tròn như giun phổi, giun roi, giun nốt, giun ký sinh nội mạc, giun đũa và giun chỉ; lớp sán dây như *Spirometra erinacei*, *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* và *Echinococcus multilocularis*; trematodes như *Schistosoma japonicum* và *Fasciola hepatica*; và protozoa như coccidia, *Plasmodium*, intestinal *Sarcocystis*, *Toxoplasma* và *Cryptosporidium*.

Ví dụ cụ thể về vật ký sinh ngoài bao gồm các vật ký sinh ngoài sau đây: từ bộ Enoplida, ví dụ, *Trichuris* spp. (trùng roi), *Capillaria* spp. (giun tóc),

Trichomosoides spp., *Trichinella* spp. (giun đũa), v.v...;

từ bộ Rhabditida, ví dụ, *Micronema* spp., *Strongyloides* spp., v.v...;

từ bộ Strongylida, ví dụ, *Strongylus* spp. (giun lươn), *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *xyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp. (sâu nốt sần), *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp. (*Stephanurus dentatus*), *Ancylostoma* spp. (*Ancylostoma duodenale*), *Uncinaria* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp. (lungworms), *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostrongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Angiostrongylus* spp. (*Angiostrongylus cantonensis*), *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp. (giun tròn), *Haemonchus* spp. (*Haemonchus contortus*), *Ostertagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp. (tuyến trùng), *Hyostrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp., v.v...;

từ bộ Oxyurida, ví dụ, *Oxyuris* spp. (*Oxyuris equi*), *Enterobius* spp. (giun kim), *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspiculuris* spp., *Heterakis* spp., v.v...;

từ bộ Ascaridia, ví dụ, *Ascaris* spp. (giun đũa), *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp. (*Toxocara canis*), *Parascaris* spp. (*Parascaris equorum*), *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp., v.v...;

từ bộ Spirurida, ví dụ, *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp. (*Dracunculus medinensis*), v.v...;

từ bộ Filariida, ví dụ, *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp. (*Dirofilaria immitis*), *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., v.v...; và

từ bộ Gigantorhynchida, ví dụ, *Filicollis* spp., *Moniliformis* spp., *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp., v.v...

Chất phòng trừ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn theo công thức chung (1)

theo sáng chế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính có hiệu quả chống lại không chỉ ký sinh trùng sống trong cơ thể của vật chủ trung gian hoặc vật chủ cuối cùng, nhưng cũng có thể ký sinh sống trong cơ thể vật chủ chứa. Hợp chất được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của nó có hiệu quả ở mọi giai đoạn phát triển của ký sinh trùng. Ví dụ, trong trường hợp động vật nguyên sinh, hợp chất này có hiệu quả chống lại u nang, dạng tiền nang và các dạng sinh dưỡng của chúng; thể liệt sinh và amip ở giai đoạn vô tính; tế bào mẹ giao tử, giao tử và hợp tử ở giai đoạn hữu tính; trùng roi; v.v... Trong trường hợp giun tròn, hợp chất này có hiệu quả chống lại trứng, ấu trùng và loài trưởng thành của chúng. Hợp chất theo sáng chế không chỉ có khả năng chống lại ký sinh trùng trong cơ thể sống, mà còn có thể ngăn ngừa nhiễm ký sinh trùng nội ký sinh hoặc ngoại ký sinh bằng cách áp dụng vào môi trường như con đường lây nhiễm. Ví dụ, nó có thể ngăn ngừa sự xuất hiện của nhiễm trùng từ đất, tức là nhiễm trùng từ đất của ruộng trồng trọt và công viên; nhiễm trùng qua da từ nước sông, hồ, đầm lầy, ruộng lúa, v.v ...; nhiễm trùng qua đường miệng từ phân của động vật như chó và mèo; nhiễm trùng qua đường miệng từ cá nước mặn, cá nước ngọt, giáp xác, động vật có vỏ, thịt sống của động vật nuôi, vv; nhiễm trùng từ muỗi, ruồi trâu, ruồi, gián, ve và bọ ve, bọ chét, chấy rận, bọ sát thủ, ve trombiculid, v.v ...; và tương tự.

Việc sử dụng ở động vật có vú và chim sẽ được mô tả dưới đây. Để kiểm soát ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh ở động vật có vú và chim bằng cách sử dụng hợp chất theo sáng chế, lượng hữu hiệu của hợp chất theo sáng chế với tá dược được phẩm có thể được phân phối qua đường miệng; dùng qua đường tiêm như tiêm (tiêm bắp, tiêm dưới da, tiêm tĩnh mạch, trong màng bụng); hoặc sử dụng qua da hoặc qua mũi như chấm, xịt, tắm, rửa, bôi lên, chấm, hoặc phủ. Để sử dụng hợp chất theo sáng chế, cũng có thể sử dụng các sản phẩm được đúc có chứa hợp chất, chẳng hạn như dải, tấm, băng, vòng cổ, dầu tai, băng chi và thiết bị dán nhãn, cũng có thể được sử dụng. Hợp chất theo sáng chế có thể được bào chế thành dạng liều bất kỳ phù hợp với đường sử dụng được lựa chọn sao cho thích hợp.

Ví dụ về dạng bào chế của hợp chất theo sáng chế bao gồm các chế phẩm rắn, chẳng hạn như bột, hạt, bột có thể thấm ướt, viên, viên nén, viên thuốc lớn, viên nang và các sản phẩm đúc có chứa hợp chất theo sáng chế; các chế phẩm dạng lỏng có thể

hòa tan trong nước hoặc dạng dầu, chẳng hạn như dung dịch tiêm, dung dịch uống, dung dịch để sử dụng trên da động vật hoặc trong các khoang cơ thể (ví dụ: dung dịch tại chỗ, dung dịch đổ) và nhũ tương; các chế phẩm dạng huyền phù như chất chảy; và các chế phẩm bán rắn như thuốc mỡ và gel. Các chế phẩm rắn có thể được sử dụng chủ yếu để uống hoặc dùng qua da sau khi pha loãng với nước, hoặc để xử lý môi trường.

Các chế phẩm rắn có thể được sản xuất bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế, và nếu cần chất hỗ trợ, với chất độn thích hợp và sau đó định hình hỗn hợp thành dạng mong muốn. Ví dụ về chất độn thích hợp bao gồm các chất vô cơ như muối cacbonat, muối hydro cacbonat, muối photphat, nhôm oxit, silic dioxide và đất sét; và các chất hữu cơ như đường, xenluloza, ngũ cốc xay và tinh bột.

Các dung dịch tiêm có thể được tiêm tĩnh mạch, tiêm bắp, hoặc tiêm dưới da. Các dung dịch tiêm có thể được sản xuất bằng cách hòa tan hợp chất theo sáng chế trong dung môi thích hợp, và nếu cần, thêm các tá dược như chất hòa tan, axit, bazơ, muối đệm, chất chống oxy hóa và chất bảo vệ vào dung dịch. Ví dụ về dung môi thích hợp bao gồm nước, etanol, butanol, rượu benzyl, glyxerin, propylen glycol, polyetylen glycol, N-metyl pyrrolidon và hỗn hợp của chúng, dầu thực vật được chấp nhận về mặt dược tính và dầu tổng hợp thích hợp để tiêm. Ví dụ về tác nhân hòa tan bao gồm polyvinyl pyrrolidon, dầu thầu dầu polyoxyetyl hóa, và este sorbitan polyoxyetyl hóa. Ví dụ về chất bảo vệ bao gồm rượu benzyl, triclobutanol, este của axit p-hydroxybenzoic và n-butanol.

Các dung dịch uống có thể được dùng trực tiếp hoặc sau khi pha loãng. Các dung dịch uống có thể được chuẩn bị theo công nghệ dược phẩm thông thường và được thiết lập tốt như với các dung dịch tiêm.

Các chất chảy, nhũ tương và các chất tương tự có thể được sử dụng qua da trực tiếp hoặc sau khi pha loãng, hoặc được sử dụng theo cách thân thiện với môi trường.

Các giải pháp sử dụng trên da động vật có thể được sử dụng bằng cách đổ lên, rải, xoa vào, phun, phân tán hoặc nhúng (nhúng, tắm, rửa) hoặc bôi. Các dung dịch này có thể được điều chế như mô tả ở trên đối với các dung dịch tiêm.

Các dung dịch đổ lên và dung dịch tại chỗ được nhỏ hoặc phun lên một vùng xác định của da động vật, và do đó hợp chất theo sáng chế được phép thấm qua da động

vật và hoạt động theo hệ thống. Dung dịch đồ tại chỗ và dung dịch tại chỗ có thể được chuẩn bị bằng cách hòa tan, tạo huyền phù hoặc nhũ hóa thành phần hoạt tính trong dung môi thích hợp hoặc dung môi hỗn hợp thích hợp để sử dụng trên da động vật. Nếu cần, có thể chứa chất bổ trợ như chất hoạt động bề mặt, chất tạo màu, chất tăng cường hấp thụ, chất chống oxy hóa, chất khử bọt, chất ổn định ánh sáng và/hoặc chất kết dính. Ví dụ về dung môi bao gồm nước, alkanol, glycol, polyetylen glycol, polypropylen glycol, glyxerin, rượu benzyl, phenyletanol, phenoxyetanol, etyl axetat, butyl axetat, benzyl benzoat, dipropylen glycol monometyl ete, dietylen glycol monobutyl ete, axeton, metyl etyl keton, hydrocacbon thơm và/hoặc béo, dầu thực vật hoặc dầu tổng hợp, DMF (dimetylformamit), parafin lỏng, parafin lỏng nhẹ, silic, dimetylaxetamit, N-metyl pyrrolidon và 2,2-dimetyl-4-oxy-metylen-1,3 -dioxolan. Ví dụ về chất tăng cường hấp thụ bao gồm DMSO (dimetyl sulfoxit), isopropyl myristat, dipropylen glycol pelargonat, dầu silic, este béo, chất béo trung tính, và rượu béo. Ví dụ về chất chống oxy hóa bao gồm muối sulfit, muối metabisulfit, axit ascorbic, hydroxytoluen butyl hóa, hydroxyanisol butyl hóa và tocopherol.

Các nhũ tương có thể được cung cấp qua đường miệng, qua da, hoặc tiêm. Các nhũ tương có thể được chuẩn bị bằng cách hòa tan thành phần hoạt tính trong pha kỵ nước hoặc ưa nước và đồng nhất hỗn hợp của dung dịch này và dung môi pha kia với việc bổ sung chất nhũ hóa thích hợp và nếu cần chất bổ trợ như chất tạo màu, chất tăng cường hấp thụ, chất bảo vệ, chất chống oxy hóa, chất chắn sáng và/hoặc chất làm đặc.

Ví dụ về pha kỵ nước (dầu) bao gồm dầu parafin, dầu silicon, dầu mè, dầu hạnh nhân, dầu thầu dầu; triglyxerit tổng hợp, triglycerit của axit béo chuỗi trung bình (triglycerit với axit caprylic (C_8) hoặc axit capric (C_{10}), v.v.); các este như etyl stearat, di-n-butyryl adipat, hexyl laurat, dipropylen glycol pelargonat, este glyxerol của axit béo mạch ngắn phân nhánh và axit béo no chiều dài chuỗi C_{16} - C_{18} , isopropyl myristat, isopropyl palmitat, caprylic hoặc este của axit capric của rượu béo bão hòa độ dài chuỗi C_{12} - C_{18} , isopropyl stearat, oleyl oleat, dexyl oleat, etyl oleat, etyl lactat, sáp axit béo este, dibutyl phtalat và diisopropyl adipat; và rượu như rượu isotridexyl, 2-octyldodecanol, rượu xetyl stearyl, và rượu oleyl.

Ví dụ về pha ưa nước bao gồm nước, propylen glycol, glyxerin và sorbitol.

Ví dụ về chất nhũ hóa bao gồm chất hoạt động bề mặt không ion như dầu thầu

dầu polyoxyetyl hóa, sorbitan monoolefinat polyoxyetyl hóa, sorbitan monostearat, glyxeryl monostearat, polyoxyetyl stearat và alkylphenol polyglycol ete; chất hoạt động bề mặt lưỡng tính như dinatri N-lauryl β -iminodipropionat và lexithin; chất hoạt động bề mặt anion như natri lauryl sulfat, cồn béo ete sulfat, và muối monoetanolamin của este axit mono-/di-alkyl polyglycol orthophosphoric; và chất hoạt động bề mặt cation như xetyltrimetylammonium clorua.

Ví dụ về chất khử bọt bao gồm silic Shin-etsu (do Shin-Etsu Chemical Co., Ltd. sản xuất), silic SM 5512 (do Toray Dow Corning silic Co. Ltd. sản xuất), ANTIFOAM E-20 (do Kao Corporation sản xuất), và SILFOAM SE 39 (do Wacker Asahikasei silic Co., Ltd. sản xuất).

Các chất bổ trợ khác bao gồm carboxymetyl xenluloza, metyl xenluloza, polyacrylat, alginat, gelatin, gôm arabic, polyvinyl pyrrolidon, rượu polyvinyl, metyl vinyl ete, chất đông trùng hợp anhydrit maleic, polyetylen glycol, sáp, và silica dạng keo.

Các chế phẩm bán rắn có thể được sử dụng bằng cách bôi hoặc trải chúng trên da động vật hoặc đưa chúng vào các khoang cơ thể. Gel có thể được điều chế bằng cách tạo ra dung dịch như đã mô tả ở trên cho các dung dịch tiêm và thêm vào dung dịch chất làm đặc với lượng đủ để tạo ra chất nhót trong suốt, giống như thuốc mỡ.

Trong trường hợp chất kiểm soát ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh theo sáng chế được sử dụng làm dược phẩm cho động vật là người, động vật có vú không phải người hoặc các loài gia cầm, thì lượng tối ưu (lượng hiệu quả) của thành phần hoạt tính thay đổi tùy theo mục đích (điều trị hoặc phòng ngừa), loại ký sinh trùng truyền nhiễm, loại và mức độ nghiêm trọng của nhiễm trùng, dạng bào chế, v.v., nhưng nói chung, liều uống hàng ngày nằm trong khoảng 0,0001 đến 10000 mg/kg thể trọng và liều hàng ngày qua đường tiêm nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 10000 mg/kg thể trọng. Liều như vậy có thể được dùng như liều duy nhất hoặc chia làm nhiều lần.

Nồng độ của thành phần hoạt tính trong chất kiểm soát ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh theo sáng chế nói chung là khoảng 0,001 đến 100% khối lượng, tốt hơn là khoảng 0,001 đến 99% khối lượng, và tốt hơn nữa là khoảng 0,005 đến 20% khối lượng. Chất phòng trừ nội ký sinh theo sáng chế có thể là chế phẩm có thể được sử dụng trực tiếp hoặc chế phẩm có nồng độ cao cần được pha loãng đến nồng độ thích hợp trước khi sử dụng.

dụng.

Chất phòng trừ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh theo sáng chế có thể được sử dụng kết hợp với bất kỳ chất phòng trừ ngoại ký sinh hiện có nhằm mục đích củng cố hoặc bổ sung tác dụng của nó. Trong cách sử dụng kết hợp như vậy, hai hoặc nhiều thành phần hoạt tính có thể được trộn lẫn và bào chế thành chế phẩm duy nhất trước khi sử dụng, hoặc hai hoặc nhiều chế phẩm khác nhau có thể được sử dụng riêng biệt.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính sẽ được mô tả sau đây. Hợp chất theo sáng chế có tác dụng phòng trừ đáng kể đối với các loài gây hại được mô tả ở trên, chúng gây hại cho cây trồng ở vùng đất thấp, cây trồng ngoài đồng ruộng, cây ăn quả, rau, cây trồng khác, cây cảnh có hoa, v.v. Hiệu quả mong muốn có thể đạt được khi thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt được áp dụng cho các cơ sở ươm cây giống, ruộng lúa, đồng ruộng, cây ăn quả, rau, cây trồng khác, cây cảnh có hoa, v.v. và hạt của chúng, nước lúa, tán lá, chất trồng chẳng hạn như đất, hoặc tương tự vào thời điểm thích hợp tùy thuộc vào thời gian dự kiến của dịch hại, tức là trước khi nhiễm dịch hại hoặc sau khi xác nhận nhiễm dịch hại. Đặc biệt, ứng dụng tổng hợp được ưu tiên. Đó là, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt được áp dụng cho đất ươm, đất trong hố cấy, chân cây, nước tưới, nước trồng trọt trong hệ thống thủy canh, hoặc tương tự để hợp chất theo sáng chế được hấp thụ một cách có hệ thống vào cây trồng, cây cảnh có hoa, v.v. qua rễ qua đất hoặc bằng cách khác.

Thực vật hữu ích mà thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế có thể được áp dụng không được giới hạn cụ thể. Ví dụ về thực vật hữu ích bao gồm ngũ cốc (ví dụ: gạo, lúa mạch, lúa mì, lúa mạch đen, yến mạch, ngô, v.v.), các loại đậu (ví dụ: đậu nành, đậu azuki, đậu tằm, đậu xanh, đậu tây, đậu phộng, v.v.), cây ăn quả và trái cây (ví dụ: táo, trái cây họ cam quýt, lê, nho, đào, mận, anh đào, quả óc chó, hạt dẻ, hạnh nhân, chuối, v.v.), rau ăn lá và trái cây (ví dụ: bắp cải, cà chua, rau bina, bông cải xanh, rau diếp, hành tây, hành lá (hẹ, hành xứ Wales, v.v.), ớt xanh, cà tím, dâu tây, tiêu, đậu bắp, họ Trung Quốc, v.v.), rau củ (ví dụ: cà rốt, khoai tây, khoai lang, khoai môn, củ cải Nhật Bản, củ cải, củ sen, củ ngưu bàng, tỏi, hành lá Trung

Quốc, v.v.), cây trồng để chế biến (ví dụ: bông, cây gai dầu, củ cải đường, hoa bia, mía, củ cải đường, ô liu, cao su, cà phê, thuốc lá, chè, v.v.), bầu bí (ví dụ: bí ngô Nhật Bản, dưa chuột, dưa hấu, dưa ngọt phương Đông, dưa lưới, v.v.), cỏ chăn nuôi (ví dụ: cỏ vườn, lúa miến, timothy, cỏ ba lá, cỏ linh lăng, v.v.), cỏ cỏ (ví dụ: Hàn Quốc cỏ bãi cỏ, cỏ uốn cong, v.v.), cây gia vị và cây thơm và cây cảnh (ví dụ: hoa oải hương, hương thảo, cỏ xạ hương, mùi tây, tiêu, gừng, v.v.), cây cảnh có hoa (ví dụ: hoa cúc, hoa hồng, hoa cẩm chướng, phong lan, tulip, lily, v.v.), cây trong vườn (ví dụ: cây bạch quả, cây anh đào, aucuba Nhật Bản, v.v.) và cây rừng (ví dụ: *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, cây thông, cây tuyết tùng vàng, cây tuyết tùng Nhật Bản, cây bách hinoki, cây bạch đàn, v.v.).

“Thực vật” cũng bao gồm các cây có khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật nhân giống cổ điển hoặc kỹ thuật tái tổ hợp gen. Ví dụ về khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ như vậy bao gồm khả năng chống chịu với các chất ức chế HPPD, chẳng hạn như isoxaflutol; thuốc ức chế ALS, chẳng hạn như imazethapyr và thifensulfuron-metyl; chất ức chế tổng hợp EPSP, chẳng hạn như glyphosat; chất ức chế glutamin synthetase, chẳng hạn như glufosinat; chất ức chế axetyl-CoA carboxylase, chẳng hạn như sethoxydim; hoặc các chất diệt cỏ khác, chẳng hạn như bromoxynil, dicamba và 2,4-D.

Ví dụ về cây trồng có khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ bằng kỹ thuật nhân giống cổ điển bao gồm các giống hạt cải dầu, lúa mì, hướng dương và lúa chống chịu với họ imidazolinon của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như imazethapyr, và những cây như vậy được bán dưới tên thương mại là Clearfield (đã đăng ký Nhân hiệu). Ngoài ra còn có nhiều loại đậu tương được cung cấp khả năng chống chịu với họ sulfonyl ure của thuốc diệt cỏ ức chế ALS như thifensulfuron-metyl bằng kỹ thuật nhân giống cổ điển, và loại đậu tương này được bán dưới tên thương mại là đậu tương STS. Cũng bao gồm các cây trồng có khả năng chống chịu với các chất ức chế axetyl-CoA cacboxylase như thuốc diệt cỏ trione oxim và thuốc diệt cỏ axit aryloxy phenoxy propionic bằng kỹ thuật nhân giống cổ điển, ví dụ, ngô SR và các loại tương tự. Thực vật có khả năng chống chịu với các chất ức chế axetyl-CoA carboxylase được mô tả trong Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), và tương tự. Hơn nữa, các đột biến axetyl-CoA carboxylase kháng với các chất ức chế axetyl-CoA carboxylase được báo

cáo trong *Weed Science*, 53, 728-746 (2005), và tương tự, và bằng cách đưa gen của đột biến axetyl-CoA carboxylaza như vậy vào cây trồng bằng cách kỹ thuật tái tổ hợp gen, hoặc đưa đột biến chuyển gen kháng vào axetyl-CoA carboxylase của thực vật, cây trồng có khả năng chống chịu với chất ức chế axetyl-CoA carboxylase có thể được thiết kế. Ngoài ra, bằng cách đưa axit nucleic gây đột biến thay thế bazơ vào tế bào thực vật (ví dụ điển hình của kỹ thuật này là kỹ thuật tạo hình chimera (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. *Science* 285: 316-318.)) để cho phép xác định vị trí đột biến thay thế trong các axit amin được mã hóa bởi gen axetyl-CoA carboxylase, gen ALS hoặc tương tự của thực vật, thực vật chịu được chất ức chế axetyl-CoA carboxylaza, chất ức chế ALS hoặc tương tự có thể được tạo ra. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế cũng có thể được áp dụng cho những loại cây này.

Các chất độc được sử dụng kết hợp với hợp chất theo sáng chế hoặc muối của chúng sẽ được mô tả sau đây. Các chất độc điển hình được biểu hiện trong thực vật biến đổi gen bao gồm các protein diệt côn trùng của *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; *Bacillus thuringiensis* δ -endotoxins, như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 và Cry9C, và các protein diệt côn trùng khác, chẳng hạn như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A; protein diệt côn trùng tuyến trùng; chất độc do động vật tiết ra, chẳng hạn như chất độc của bọ cạp, chất độc của nhện, chất độc của ong và chất độc thần kinh đặc hiệu của côn trùng; độc tố của nấm sợi; lectin thực vật; ngưng kết; chất ức chế proteaza, chẳng hạn như chất ức chế trypsin, chất ức chế serin proteaza, chất ức chế patatin, xystatin và papain; protein bất hoạt ribosome (RIP), chẳng hạn như ricin, ngô RIP, abrin, luffin, saporin và bryodin; các enzym chuyển hóa steroid, chẳng hạn như 3-hydroxy steroid oxidase, ecdysteroid-UDP-glucosyltransferase và cholesterol oxidase; thuốc ức chế ecdyson; HMG-CoA reductaza; thuốc ức chế kênh ion, chẳng hạn như thuốc ức chế kênh natri và thuốc ức chế kênh canxi; juvenile hormone esterase; thụ thể diuretic hormone; stilben syntaza; bibenzyl syntaza; chitinaza; và glucanaza.

Ngoài ra còn có các độc tố lai hóa, độc tố thiếu hụt một phần và độc tố biến đổi có nguồn gốc từ các chất sau: δ -Protein -endotoxin như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab và Cry35Ab, và các protein

diệt côn trùng khác như VIP1, VIP2, VIP3 và VIP3A. Độc tố lai có thể được tạo ra bằng cách kết hợp một số vùng của các protein này khác với sự kết hợp ban đầu trong tự nhiên với việc sử dụng kỹ thuật tái tổ hợp. Như độc tố bị thiếu hụt một phần, độc tố Cry1Ab trong đó một phần của trình tự axit amin bị xóa được biết đến. Trong độc tố biến đổi, một hoặc nhiều axit amin của độc tố có trong tự nhiên được thế.

Ví dụ về các chất độc nói trên và thực vật biến đổi gen có khả năng tổng hợp các chất độc này được mô tả trong EP0374753A, WO93 / 07278, WO95 / 34656, EP0427529A, EP451878A, WO03 / 052073, v.v.

Do các chất độc có trong thực vật biến đổi gen như vậy, cây trồng có khả năng chống lại sâu bệnh, cụ thể là côn trùng gây hại bộ Coleopteran, côn trùng gây hại Hemipteran, côn trùng gây hại Dipteran, côn trùng gây hại Lepidopteran và tuyến trùng. Các công nghệ được mô tả ở trên và thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế có thể được sử dụng kết hợp hoặc được sử dụng một cách có hệ thống.

Khi thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc cây trồng theo sáng chế được sử dụng để kiểm soát côn trùng gây hại hoặc tuyến trùng mục tiêu, nó có thể được pha loãng hoặc không được pha loãng hoặc lơ lửng trong nước, v.v., và lượng hiệu quả của nó để kiểm soát sâu bệnh hoặc tuyến trùng được áp dụng cho các cây trồng có khả năng bị nhiễm mục tiêu là côn trùng gây hại hoặc tuyến trùng. Ví dụ, để kiểm soát côn trùng gây hại hoặc tuyến trùng có thể gây hại cho cây trồng như cây ăn quả, ngũ cốc và rau, có thể thực hiện bón lá và cũng có thể xử lý hạt giống, chẳng hạn như nhúng, phủ bụi và phủ canxi peroxit lên hạt giống, có thể được thực hiện. Ngoài ra, việc xử lý đất hoặc tương tự cũng có thể được thực hiện để cho phép cây trồng hấp thụ các chất hóa học nông nghiệp qua rễ của chúng. Ví dụ về xử lý như vậy bao gồm trộn toàn bộ đất, xử lý hàng trồng, kết hợp đất luống, xử lý cây con cấy, xử lý hố trồng, xử lý chân cây, bón thúc, xử lý hộp ươm lúa và bón ngập. Ngoài ra, ứng dụng cho giá thể trồng trọt trong thủy canh, xử lý thuốc lá, tiêm thân cây, và tương tự cũng có thể được thực hiện.

Hơn nữa, Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế, có hoặc không pha loãng hoặc huyền phù trong nước, v.v., có thể được áp dụng cho các vị trí có khả năng bị nhiễm dịch hại với một lượng có hiệu quả để kiểm soát dịch hại. Ví

dụ, có thể thực hiện phun xử lý côn trùng hại hạt lưu trữ, côn trùng hại nhà, sâu bệnh vệ sinh, dịch hại rừng, v.v., và cũng có thể thực hiện xử lý lớp phủ, khói, hoặc bầy của vật liệu xây dựng khu dân cư.

Các phương pháp xử lý hạt giống mẫu bao gồm nhúng hạt vào dung dịch pha loãng hoặc chưa pha loãng của công thức lỏng hoặc rắn để các chất nông được thẩm thấu vào hạt; trộn hoặc phủ bụi hạt bằng công thức rắn hoặc lỏng để công thức bám dính trên bề mặt hạt; phủ hạt bằng hỗn hợp công thức rắn hoặc lỏng và chất mang kết dính như nhựa và polyme; và áp dụng công thức rắn hoặc lỏng cho vùng lân cận của hạt giống cùng lúc với việc gieo hạt.

Thuật ngữ “hạt giống” trong xử lý hạt giống dùng để chỉ thân thực vật đang ở giai đoạn đầu của quá trình trồng trọt và được sử dụng để nhân giống cây trồng. Các ví dụ bao gồm, ngoài các đối tượng được gọi là hạt, cơ thể thực vật để nhân giống sinh dưỡng, chẳng hạn như củ, rễ củ, củ khoai tây giống, mầm kẽ lá, cây mầm, thân đĩa và thân dùng để cắt cành.

Thuật ngữ “đất” hoặc “môi trường trồng” trong phương pháp của sáng chế để sử dụng Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt đề cập đến một phương tiện hỗ trợ cho việc canh tác cây trồng, cụ thể là một phương tiện hỗ trợ cho phép cây trồng mọc rễ trong đó, và các vật liệu không bị giới hạn cụ thể miễn là chúng cho phép thực vật phát triển. Ví dụ về môi trường hỗ trợ bao gồm những gì được gọi là đất, thảm cây con và nước, và các ví dụ cụ thể về vật liệu bao gồm cát, đá bột, vermiculite, diatomit, agar, chất sền sệt, chất có trọng lượng phân tử cao, len đá, bông thủy tinh, dăm gỗ và vỏ cây.

Các phương pháp điển hình trong việc ứng dụng cho tán lá cây trồng hoặc đối với sâu hại ngũ cốc, sâu bọ hại nhà, sâu bệnh vệ sinh, sâu bệnh hại rừng, v.v. bao gồm việc áp dụng các công thức lỏng như chất cô đặc có thể nhũ hóa hoặc chất lỏng, hoặc các công thức rắn như bột có thể thấm ướt hoặc hạt phân tán trong nước sau pha loãng thích hợp trong nước. Cũng bao gồm các ứng dụng bụi và hút thuốc.

Các phương pháp làm đất ví dụ bao gồm áp dụng công thức chất lỏng pha loãng hoặc không pha loãng trong nước vào chân cây, luống ươm cây con, hoặc tương tự; bón hạt vào chân cây, luống ươm cây con, hoặc tương tự; phủ bụi, bột có thể thấm ướt, hạt, hạt phân tán trong nước, hoặc tương tự lên đất và sau đó trộn công thức vào toàn

bộ đất trước khi gieo hoặc cấy; và sử dụng các loại bụi, bột có thể thấm ướt, hạt phân tán trong nước, hạt nhỏ, hoặc các loại tương tự vào hố trồng, hàng trồng, hoặc tương tự trước khi gieo hạt hoặc trồng cây.

Trong trường hợp áp dụng vào hộp ươm cho lúa thì sử dụng hạt bụi, hạt phân tán trong nước, dạng hạt hoặc các loại tương tự tùy thuộc vào việc bón vào thời điểm gieo hạt, thời kỳ hồi xanh, thời điểm cấy ghép, hoặc tương tự. Công thức như vậy có thể được áp dụng bằng cách trộn vào đất ươm. Ví dụ, bụi, hạt phân tán trong nước, hạt nhỏ, hoặc tương tự có thể được kết hợp vào đất luống, đất phủ hoặc toàn bộ đất ươm. Theo cách đơn giản, đất ươm và công thức như vậy có thể được xếp xen kẽ.

Trong ứng dụng cho ruộng lúa, các công thức rắn như jumbos, bao gói, hạt và hạt phân tán trong nước, hoặc các công thức lỏng như chất chảy và chất cô đặc có thể nhũ hóa thường được áp dụng cho ruộng lúa ngập nước. Ngoài ra, vào thời điểm trồng lúa, một công thức thích hợp có thể được bón hoặc tiêm vào đất nguyên gốc hoặc sau khi trộn với phân bón, v.v. Ngoài ra, nguồn nước chảy vào ruộng lúa, chẳng hạn như dầu vào nước và hệ thống tưới tiêu, có thể được xử lý bằng chất cô đặc có thể nhũ hóa, chất tạo dòng chảy, hoặc tương tự. Trong trường hợp này, việc áp dụng cho các cánh đồng lúa có thể được thực hiện với việc cung cấp nước và do đó đạt được một cách tiết kiệm lao động.

Đối với cây trồng ngoài đồng ruộng, hạt giống, chất trồng gần cây của chúng hoặc tương tự có thể được xử lý bằng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc cây trồng theo sáng chế trong giai đoạn từ khi gieo hạt đến khi nuôi cấy cây con. Trong trường hợp cây trồng gieo hạt trực tiếp trên đồng ruộng, thì việc xử lý hạt giống trực tiếp được ưu tiên hơn và việc xử lý chân cây trong quá trình canh tác cũng được ưu tiên hơn. Cụ thể, có thể thực hiện ứng dụng dạng hạt hoặc xử lý rãnh với công thức ở dạng lỏng được pha loãng trong nước hoặc không pha loãng. Theo cách xử lý thích hợp khác là trộn hạt vào môi trường trồng trước khi gieo hạt.

Trong trường hợp cây trồng để cấy ghép, các ví dụ thích hợp về xử lý trong giai đoạn từ khi gieo hạt đến giai đoạn cây con bao gồm xử lý hạt giống trực tiếp; xử lý rãnh trong luống ươm cho cây con bằng chế phẩm ở dạng lỏng; và ứng dụng hạt vào luống ươm cây con. Cũng bao gồm xử lý hố trồng bằng hạt tại thời điểm trồng cố định; và kết hợp các hạt với giá thể trồng ở gần các điểm cấy tại thời điểm trồng cố định.

Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế thường được sử dụng như một công thức thuận tiện cho việc ứng dụng, được điều chế theo phương pháp thông thường để điều chế các công thức hóa chất nông nghiệp. Nghĩa là, hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) theo sáng chế hoặc muối của chúng và chất mang không hoạt động thích hợp, và nếu cần chất bổ trợ, được trộn với tỷ lệ thích hợp, và thông qua các bước hòa tan, tách, huyền phù, trộn, ngâm tẩm, hấp phụ và/hoặc kết dính, được pha chế thành dạng thích hợp để ứng dụng, chẳng hạn như chất cô đặc huyền phù, chất cô đặc có thể nhũ hóa, chất cô đặc hòa tan, bột có thể thấm ướt, nước-hạt phân tán, hạt, bụi, viên nén và gói.

Chế phẩm (thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt hoặc chất kiểm soát ký sinh trùng động vật) theo sáng chế có thể tùy chọn chứa chất phụ gia thường được sử dụng cho các công thức hóa chất nông nghiệp hoặc chất kiểm soát ký sinh trùng động vật ngoài thành phần hoạt chất. Ví dụ về chất phụ gia bao gồm các chất mang như chất mang rắn hoặc lỏng, chất hoạt động bề mặt, chất phân tán, chất làm ướt, chất kết dính, chất kết dính, chất làm đặc, chất tạo màu, chất phết, chất dính/trải, chất chống đông, chất chống đóng cục, chất phân hủy và chất ổn định. Nếu cần, chất bảo quản, mảnh thực vật, v.v. cũng có thể được sử dụng làm chất phụ gia. Một trong những chất phụ gia này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng hai hoặc nhiều chất phụ gia kết hợp với nhau.

Ví dụ về chất mang rắn bao gồm các khoáng chất tự nhiên, chẳng hạn như thạch anh, đất sét, kaolinit, pyrophyllit, sericit, talc, bentonit, đất sét axit, attapulgit, zeolit và diatomit; muối vô cơ, chẳng hạn như canxi cacbonat, amoni sulfat, natri sulfat và kali clorua; chất mang chất rắn hữu cơ, chẳng hạn như axit silicic tổng hợp, silicat tổng hợp, tinh bột, xenlulo và bột thực vật (ví dụ, mùn cưa, vỏ dừa, lõi ngô, thân cây thuốc lá, v.v.); chất mang chất dẻo, chẳng hạn như polyetylen, polypropylen và polyvinylidene clorua; phân urê; vật liệu vô cơ rỗng; vật liệu nhựa rỗng; và silica dạng khối (carbon trắng). Một trong các chất mang rắn này có thể được sử dụng một mình, và hai hoặc nhiều trong số chúng có thể được sử dụng kết hợp.

Ví dụ về chất mang chất lỏng bao gồm rượu bao gồm rượu monohydric, chẳng hạn như metanol, etanol, propanol, isopropanol và butanol, và rượu polyhydric, chẳng

hạn như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, hexylen glycol, polyetylen glycol, polypropylen glycol và glycerin; các hợp chất polyol, chẳng hạn như ete propylen glycol; xeton, chẳng hạn như axeton, metyl etyl xeton, metyl isobutyl xeton, diisobutyl xeton và xyclohexanone; ete, chẳng hạn như ete etylic, dioxan, etylen glycol monoetylen ete, dipropyl ete và tetrahydrofuran; hydrocacbon béo, chẳng hạn như parafin thông thường, naphthene, isoparafin, dầu hỏa và dầu khoáng; hydrocacbon thơm, chẳng hạn như benzen, toluen, xylen, dung môi naphtha và alkyl naphtalen; hydrocacbon béo halogen hóa, chẳng hạn như diclometan, cloform và cacbon tetraclorea; este, chẳng hạn như etyl axetat, diisopropyl phthalat, dibutyl phthalat, dioctyl phthalat và dimetyl adipate; lacton, chẳng hạn như γ -butyrolacton; amit, chẳng hạn như dimetylformamit, dietylfornamit, dimetylxetamit và N-alkyl pyrrolidinon; nitril, chẳng hạn như axetonitril; các hợp chất lưu huỳnh, chẳng hạn như dimetyl sulfoxit; dầu thực vật, chẳng hạn như dầu đậu nành, dầu hạt cải dầu, dầu hạt bông và dầu thầu dầu; và nước. Một trong các chất mang chất lỏng này có thể được sử dụng một mình, và cũng có thể sử dụng kết hợp hai hoặc nhiều chất mang trong số chúng.

Các chất hoạt động bề mặt được lấy làm ví dụ được sử dụng làm chất phân tán hoặc chất làm ướt/trải rộng bao gồm chất hoạt động bề mặt không ion, chẳng hạn như este axit béo sorbitan, este axit béo polyoxyetylen sorbitan, este axit béo sacaroza, este axit béo polyoxyetylen, este axit nhựa polyoxyetylen, diester axit béo polyoxyetylen, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyetylen alkyl aryl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete, polyoxyetylen dialkyl phenyl ete, polyoxyetylen alkyl phenyl ete-formaldehyde ngưng tụ, polyoxyetylen-polyoxypropylen khối copolyme, polystyrene-polyoxyetylen khối polyme, khối polyme alkyl ete-polyoxyetylen, polyoxyetylen polyoxyetylen axit béo, axit béo polyoxyetylen bis (phenyl ete), polyalkylen benzyl phenyl ete, polyoxyalkylen styryl phenyl ete, axetylen diol, polyoxyalkylen được thêm axetylen diol, silic loại polyoxyetylen ete, silic loại este, chất tạo bề mặt flo, polyoxyetylen il và dầu thầu dầu đã hydro hóa polyoxyetylen; chất hoạt động bề mặt anion, chẳng hạn như alkyl sulfat, polyoxyetylen alkyl ete sulfat, polyoxyetylen alkyl phenyl ete sulfat, polyoxyetylen styryl phenyl ete sulfat, alkylbenzen sulfonat, alkylaryl sulfonat, lignosulfonat, alkyl sulfosuccinat, axit naphtalen-sulfonat sulfonat, muối naphtalen sulfonat, các muối naphtalen sulfonat, ankan sulfonat muối của axit alkylnaphtalensulfonic ngưng

tự-fomandehit, muối axit béo, muối axit polycarboxylic, polyacrylat, N-metyl-axit béo, chất dẻo, polyoxyetylen alkyl ete photphat và polyoxyetylen alkyl phenyl ete photphat; chất hoạt động bề mặt cation bao gồm muối alkyl amin, chẳng hạn như lauryl amin hydroclorua, stearyl amin hydroclorua, oleyl amin hydroclorua, stearyl amin axetat, stearyl aminopropyl amin axetat, alkyl trimetyl amoni clorua và alkyl dimetyl benzalkonium clorua; và chất hoạt động bề mặt lưỡng tính, chẳng hạn như chất hoạt động bề mặt lưỡng tính loại axit amin hoặc betain. Một trong các chất hoạt động bề mặt này có thể được sử dụng một mình, và hai hoặc nhiều chất trong số chúng có thể được sử dụng kết hợp.

Ví dụ về chất kết dính hoặc chất dính bao gồm carboxymetyl xenluloza hoặc muối của chúng, dextrin, tinh bột hòa tan, xanthan gum, guar gum, sucrose, polyvinyl pyrrolidone, gum arabic, polyvinyl alcohol, polyvinyl axetat, natri polyacrylat, polyetylen glycol với trọng lượng phân tử trung bình là 6.000 đến 20.000, polyetylen oxit có trọng lượng phân tử trung bình từ 100.000 đến 5.000.000, photpholipit (ví dụ, cephalin, lecithin, v.v.), bột xenlulo, dextrin, tinh bột biến tính, hợp chất chelat của axit polyaminocarboxylic, polyvinyl pyrrolidon liên kết chéo, axit maleic-chất đồng trùng hợp-styren, đồng trùng hợp axit acrylic (meth), một nửa este của polyme rượu polyhydric và anhydrit dicarboxylic, polystyren sulfonat hòa tan trong nước, parafin, terpen, nhựa polyamit, polyacrylat, polyoxyetylen, sáp, polyvinyl ankyl ete, chất ngưng tụ alkylphenol-fomandehit và nhựa tổng hợp nhũ tương.

Ví dụ về chất làm đặc bao gồm các polyme hòa tan trong nước, chẳng hạn như kẹo cao su xantan, kẹo cao su guar, kẹo cao su diutan, carboxymetyl xenluloza, polyvinyl pyrrolidone, polyme cacboxyvinyl, polyme acrylic, hợp chất tinh bột và polysaccharid; và bột mịn vô cơ, chẳng hạn như bentonit lớp cao và silica bốc khói (cacbon trắng).

Ví dụ về chất tạo màu bao gồm các chất màu vô cơ, chẳng hạn như oxit sắt, oxit titan và xanh Prussian; và thuốc nhuộm hữu cơ, chẳng hạn như thuốc nhuộm alizarin, thuốc nhuộm azo và thuốc nhuộm phthaloxyanin kim loại.

Ví dụ về chất chống đông bao gồm rượu polyhydric, chẳng hạn như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol và glyxerin.

Ví dụ về tá dược phục vụ để ngăn chặn sự đóng cục hoặc tạo điều kiện phân hủy bao gồm polysaccharit (tinh bột, axit alginic, mannoza, galactosa, v.v.), polyvinyl pyrrolidon, silica bốc khói (carbon trắng), gôm este, nhựa dầu mỡ, natri tripolyphosphat, natri hexametaphosphat, kim loại stearat, bột xenlulo, dextrin, copolyme methacrylat, polyvinyl pyrrolidon, hợp chất chelat của axit polyaminocarboxylic, chất đồng trùng hợp styren-isobutylen-maleic anhydrit sulfo hóa và chất đồng trùng hợp ghép tinh bột-polyacrylonitril.

Ví dụ về chất ổn định bao gồm chất hút ẩm, chẳng hạn như zeolit, vôi sống và magie oxit; chất chống oxy hóa, chẳng hạn như hợp chất phenolic, hợp chất amin, hợp chất lưu huỳnh và hợp chất axit photphoric; và các chất hấp thụ tia cực tím, chẳng hạn như các hợp chất axit salixylic và các hợp chất benzophenon.

Ví dụ về chất bảo quản bao gồm kali sorbat và 1,2-benzothiazolin-3-on.

Hơn nữa, các chất bổ trợ khác bao gồm chất lan truyền chức năng, chất tăng cường hoạt động như chất ức chế chuyển hóa (piperonyl butoxit, v.v.), chất chống đông (propylen glycol, v.v.), chất chống oxy hóa (BHT, v.v.) và chất hấp thụ tia cực tím cũng có thể được sử dụng nếu cần.

Lượng hợp chất thành phần hoạt tính trong thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế có thể được điều chỉnh khi cần thiết, và về cơ bản, lượng hợp chất thành phần hoạt tính được lựa chọn thích hợp trong khoảng từ 0,01 đến 90 phần trọng lượng trong 100 phần bằng trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt. Ví dụ, trong trường hợp thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt ở dạng bụi, hạt, chất cô đặc có thể nhũ hóa hoặc bột có thể thấm ướt, thì lượng hợp chất thành phần hoạt tính là 0,01 đến 50 phần trọng lượng (0,01 đến 50% trọng lượng so với tổng trọng lượng của thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc cây trồng).

Tỷ lệ áp dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc cây trồng theo sáng chế có thể thay đổi tùy theo các yếu tố khác nhau, ví dụ, mục đích, loài gây hại mục tiêu, điều kiện phát triển của cây trồng, xu hướng nhiễm sâu bệnh, thời tiết, điều kiện môi trường, công thức, phương pháp ứng dụng, vị trí ứng dụng, thời gian áp dụng, v.v., nhưng về cơ bản, tỷ lệ ứng dụng của hợp chất hoạt chất được lựa chọn thích hợp từ khoảng 0,001 g đến 10 kg, tốt nhất là 0,01 g đến 1 kg trên 10 ares tùy thuộc vào mục

đích.

Hơn nữa, để mở rộng phạm vi dịch hại mục tiêu và thời gian thích hợp để kiểm soát dịch hại, hoặc để giảm liều lượng, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế có thể được sử dụng sau khi trộn với các loại thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt khác, thuốc trừ sâu, thuốc diệt thần kinh, thuốc diệt vi sinh, thuốc trừ sâu sinh học và/hoặc tương tự. Hơn nữa, thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt có thể được sử dụng sau khi trộn với thuốc diệt cỏ, chất điều hòa sinh trưởng thực vật, phân bón và/hoặc tương tự tùy theo tình hình.

Ví dụ về các loại thuốc trừ sâu, thuốc diệt cỏ và thuốc trừ sâu trồng trọt hoặc nông nghiệp bổ sung được sử dụng cho các mục đích nêu trên bao gồm 3,5-xylyl methylcarbamate (XMC), các chất độc protein tinh thể được tạo ra bởi *Bacillus thuringiensis* như *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* và *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, BPMC, Bt toxin-derived insecticidal compounds, CPCBS (clorfenson), DCIP (diclodiisopropyl ete), D-D (1,3-diclopropen), DDT, NAC, O-4-dimethylsulfamoylphenyl O,O-diethyl phosphorothioat (DSP), O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioat (EPN), tripropylisoxyanurat (TPIC), acrinathrin, azadirachtin, azinphos-metyl, axequinoxyl, axetamiprid, axetoprol, axephate, abamectin, avermectin-B, amidoflomet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, alpha-endosulfan, alpha-xypermethrin, albendazole, allethrin, isazofos, isamidofos, isoamidofos isoxathion, isofenphos, isoprocarb (MIPC), ivermectin, imixyafos, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, esfenvalerat, ethiofencarb, ethion, ethiprol, etoxazol, ethofenprox, ethoprophos, etrimfos, emamectin, emamectin-benzoate, endosulfan, empenthrin, oxamyl, oxydemeton-metyl, oxydeprofos (ESP), oxibendazole, oxfendazole, potassium oleate, natri oleate, cadusafos, cartap, carbaryl, carbosulfan, carbofuran, gamma-xyhalothrin, xylylcarb, quinalphos, kinoprene, chinomethionat, cloethocarb, clothianidin, clofentezin, chromafenozide, clorantraniliprole, clorethoxyfos, clordimeform, clordane, clorpyrifos, clorpyrifos-metyl, clorphenapyr, clorfenson, clorfenvinphos, clorfluazuron, clobenzilat, clobenzoate, kelthane (dicofol), salithion, xyanophos (xyAP), diafenthiuron, diamidafos, xyantraniliprole, theta-xypermethrin, dienoclor,

xyenopyrafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-xypermethrin, diclofenthion (ECP), xycloprothrin, diclorvos (DDVP), disulfoton, dinotefuran, xyhalothrin, xyphenothrin, xyfluthrin, diflubenzuron, xyflumetofen, diflovidazin, xyhexatin, xypermethrin, dimethylvinphos, dimethoat, dimefluthrin, silafluofen, xyromazin, spintoram, spinosad, spiroadiclofen, spirotetramat, spiromesifen, sulfluramid, sulprofos, sulfoxaflo, zeta-xypermethrin, diazinon, tau-fluvalinate, dazomet, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thioxyclo, thiosultap, thiosultap-natri, thionazin, thiometon, deet, dieldrin, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetramethylfluthrin, tetramethrin, tebupirimfos, tebufenozit, tebufenpyrad, tefluthrin, teflubenzuron, demeton-S-metyl, temephos, deltamethrin, terbufos, tralopyril, tralomethrin, transfluthrin, triazamate, triazuron, trichlomit, trichlorphon (DEP), triflumuron, tolfenpyrad, naled (BRP), nithiazin, nitenpyram, novaluron, noviflumuron, hydroprene, vaniliprole, vamidothion, parathion, parathion-metyl, halfenprox, halofenozide, bistrifluron, bisultap, hydrametylnon, hydroxy propyl starch, binapacryl, bifenazate, bifenthrin, pymetrozin, pyraclofos, pyrafluprole, pyridafenthion, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxyfen, pirimicarb, pyrimidifen, pirimiphos-metyl, pyrethrins, fipronil, fenazaquin, fenamiphos, bromopropylat, fenitrothion (MEP), fenoxycarb, fenothiocarb, phenothrin, fenobucarb, fensulfothion, fenthion (MPP), phenthoat (PAP), fenvalerate, fenpyroximat, fenpropathrin, fenbendazol, fosthiazat, formetanat, butathiofos, buprofezin, furathiocarb, prallethrin, fluacrypyrim, fluazinam, fluazuron, fluensulfon, fluxyclohexuron, fluxythrinate, fluvalinat, flupyraxofos, flufenimer, flufenoxuron, flufenzin, flufenprox, fluproxyfen, flubroxylthrin, flubendiamit, flumethrin, flurimfen, prothiofos, prothifenbut, flonicamid, propaphos, propargite (BPPS), profenofos, profluthrin, propoxur (PHC), bromopropylat, beta-xyfluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, heptenophos, permethrin, benclotiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximate, benfuracarb, phoxim, phosalone, fosthiazate, fosthietan, phosphamidon, phosphocarb, phosmet (PMP), polynactins, formetanat, formothion, phorat, dầu máy, malathion, milbemycin, milbemycin-A, milbemectin, mecarbam, mesulfenfos, metomyl, metaldehyt, metaflumizon, methamidophos, metam-ammonium, metam-natri, methiocarb, methidathion (DMTP), methylisothioxyanate, methylneodecanamit, methylparathion, metoxadiazon,

methoxycloz, methoxyfenozide, metofluthrin, methopren, metolcarb, meperfluthrin, mevinphos, monocrotophos, monosultap, lambda-xyhalothrin, ryanodin, lufenuron, resmethrin, lepimectin, rotenone, levamisol hydroclorit, fenbutatin oxit, morantel tartarat, metyl bromua, trixyclohexyltin hydroxit (xyhexatin), canxi xyanamit, canxi polysulfit, sulfur và nicotin-sulfat.

Các loại thuốc diệt vi sinh vật trồng trọt hoặc nông nghiệp được sử dụng cho các mục đích tương tự như trên bao gồm aureofungin, azaconazol, azithiram, axypetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metyl, azoxystrobin, anilazin, amisulbrom, ampropylfos, ametoctradin, rượu allyl, aldimorph, amobam, isotianil, isovaledion, isopyrazam, isoprothiolan, ipconazol, iprodion, iprovalicarb, iprobenfos, imazalil, iminoctadin, iminoctadin-albesilat, iminoctadin-triaxetat, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenphos, etaconazol, etaboxam, ethirimol, etem, etoxyquin, etridiazol, enestroburin, epoxiconazol, oxadixyl, oxycarboxin, đồng-8-quinolinolat, oxytetraoxycyclin, đồng-oxinat, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarat, axit oxolinic, octhilinon, ofurace, orysastrobin, metam-natri, kasugamycin, carbamorph, carpropamid, carbendazim, carboxin, carvon, quinazamid, quinacetol, quinoxifen, quinomethionat, captafol, captan, kiralaxyl, quinconazol, quintozen, guazatin, cufraneb, cuproban, glyodin, griseofulvin, climbazol, cresol, kresoxim-metyl, clozolinat, clotrimazol, clobenthiazon, cloraniformetan, cloranil, clorquinox, clopicrin, clorfenazole, clodinitronaphthalen, clothalonil, cloneb, zarilamid, salixylanilide, xyazofamid, diethyl pyrocarbonate, diethofencarb, xyclafuramid, dicloxytmet, diclozolin, diclobutrazol, diclofluanid, xycloheximit, diclomezin, dicloran, diclophen, diclon, disulfiram, ditalimfos, dithianon, diniconazol, diniconazole-M, zinb, dinocap, dinoceton, dinosulfon, dinoterbon, dinobuton, dinopenton, dipyrithion, diphenylamin, difenoconazole, xyflufenamid, diflunetorim, xyproconazol, xyprodinil, xyprofuram, xypendazole, simeconazol, dimethirimol, dimethomorph, xymoxanil, dimoxystrobin, metyl bromua, ziram, silthiofam, streptomycin, spiroxamin, sultropen, sedaxan, zoxamit, dazomet, thiadiazin, tiadinil, thiadiflo, thiabendazol, tioxyimid, thioclorfenphim, thiophanate, thiophanate-metyl, thixyofen, thioquinox, chinomethionat, thifluzamit, thiram, decafentin, tecnazene, tecloftalam, tecoram, tetraconazole, debacarb, dehydroacetic axit, tebuconazole, tebufloquin, dodicin, dodin,

dodexyl benzensulfonate bis-ethylene diamin đồng(II) (DBEDC), dodemorph, drazoxolon, triadimenol, triadimefon, triazbutil, triazoxide, triamiphos, triarimol, trichlamit, trixyclozol, triticonazole, tridemorph, tributyltin oxide, triflumizole, trifloxystrobin, triforin, tolylfluanid, tolclofos-metyl, natamycin, nabam, nitrothal-isopropyl, nitrostyrene, nuarimol, đồng nonylphenol sulfonate, halacrinat, validamycin, valifenalat, harpin protein, bixafen, picoxystrobin, picobenzamit, bithionol, bitertanol, hydroxyisoxazole, hydroxyisoxazole-potassium, binapacryl, biphenyl, piperalin, hymexazol, pyraoxystrobin, pyracarbolid, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrametostrobin, pyriofenone, pyridinitril, pyrifenoxy, pyribencarb, pyrimethanil, pyroxychlor, pyroxyfur, pyroquilon, vinclozolin, famoxadon, fenapanil, fenamidon, fenaminosulf, fenarimol, fenitropan, fenoxanil, ferimzon, ferbam, fentin, fencpiclonil, fenpyrazamin, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidin, fenpropimorph, fenhexamid, phthalit, buthiobat, butylamin, bupirimate, fuberidazole, blasticidin-S, furametpyr, furalaxyl, fluacrypyrim, fluazinam, fluoxastrobin, fluotrimazole, fluopicolide, fluopyram, flooimit, furcarbanil, fluxapyroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazole-xis, fludioxonil, flusilazole, flusulfamid, flutianil, flutolanil, flutriafol, furfural, furmexycloz, flumetover, flumorph, proquinazid, procloraz, proxymidone, prothiocarb, prothioconazole, propamocarb, propiconazol, propinb, furophanate, probenazole, bromuconazole, hexaclobutadien, hexaconazole, hexylthiofos, bethoxazin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, pefurazoat, benquinox, penconazol, benzamorf, penxycuron, benzohydroxamic axit, bentalluron, benthiazole, benthiavalicarb-isopropyl, penhiopyrad, penflufen, boscalid, phosdiphen, fosetyl, fosetyl-Al, polyoxins, polyoxorim, polycarbamate, folpet, formaldehyde, machin oil, maneb, mancozeb, mandipropamid, myclozolin, myclobutanil, mildiomyacin, milneb, mecarbinzid, methasulfocarb, metazoxolon, metam, metam-natri, metalaxyl, metalaxyl-M, metiram, metyl isothioxyanat, meptyldinocap, metconazol, metsulfosax, methfuroxam, metominostrobin, metrafenone, mepanipyrim, mefenoxam, meptyldinocap, mepronil, mebenil, iodomethan, rabenzazol, benzalkonium clorua, bazơ đồng clorua, bazơ đồng sulfat, inorganic microbicides như bạc, natri hypoclorit, cupric hydroxit, wettable sulfur, calcium polysulfid, potassium hydrogen carbonat, natri hydrogen carbonat, sulfur, đồng sulfat anhydrit, nickel

dimetyldithiocarbamat, các hợp chất đồng như đồng-8-quinolinolat (oxin đồng), kẽm sulfat và đồng sulfat pentahydrat.

Các chất diệt cỏ ví dụ được sử dụng cho các mục đích tương tự như trên bao gồm 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-thioetyl, MCPB, ioxynil, aclonifen, azafenidin, acifluorfen, aziprotryne, azimsulfuron, asulam, acetoclo, atrazine, atraton, anisuron, anilofos, aviglyxin, abscisic acid, amicarbazone, amidosulfuron, amitrol, aminoxyclopyraclo, aminopyralid, amibuzin, amiprofos-metyl, ametrifone, ametryn, alaclo, allidoclo, alloxydim, alorac, isouron, isocarbamid, isoxaclortol, isoxapyrifop, isoxaflutole, isoxaben, isocil, isonoruron, isoproturon, isopropalin, isopolinat, isomethiozin, inabenfit, ipazin, ipfencarbazon, iprymidam, imazaquin, imazapic, imazapyr, imazamethapyr, imazamethabenz, imazamethabenz-metyl, imazamox, imazethapyr, imazosulfuron, indaziflam, indanofan, indolebutyric acid, uniconazole-P, eglazine, esprocarb, ethametsulfuron, ethametsulfuron-metyl, ethalfluralin, ethiolate, etylclozate-etyll, ethidimuron, etinofen, ethephon, ethoxysulfuron, etoxyfen, etnipromid, ethofumesate, etobenzanid, epronaz, erbon, endothal, oxadiazon, oxadiargyl, oxaziclomefon, oxasulfuron, oxapyrazon, oxyfluorfen, oryzalin, orthosulfamuron, orbencarb, cafenstrole, cambendiclo, carbasulam, carfentrazone, carfentrazone-etyll, karbutilate, carbetamide, carboxazole, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etyll, xylaclo, quinclamine, quinonamid, quinclorac, quinmerac, cumyluron, clodinate, glyphosate, glufosinate, glufosinate-P, credazine, clethodim, cloxyfonac, clodinafop, clodinafop-propargyl, clootoluron, clopyralid, cloproxydim, cloprop, clobromuron, clofop, clomazone, chlomethoxynil, chlomethoxyfen, clomeprop, clorazifop, clorazin, cloransulam, cloranocryl, cloramben, cloransulam-metyl, clodiazon, clorimuron, clorimuron-etyll, clorsulfuron, clothal, clothiamid, clotoluron, clonitrofen, clofenac, clofenprop, clobufam, cloflurazole, cloflurenol, cloprocarb, clopropham, clomequat, cloeturon, clooxynil, clooxuron, cloopon, saflufenacil, cyanazine, cyanatryn, di-allate, diuron, diethamquat, dicamba, xycluron, xycloate, xycloxydim, diclosulam, xyclosulfamuron, dicloprop, dicloprop-P, dichlobenil, diclofop, diclofop-metyl, diclomite, dicloalurea, diquat, cisanilide, disul, siduron, dithiopyr, dinitramine,

cinidon-etyll, dinosam, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenate, dinoprop, cyhalofop-butyl, diphenamid, difenoxuron, difenopenten, difenzoquat, cybutryne, cyprazine, cyprazole, diflufenican, diflufenzopyr, dipropetryn, cypromid, cyperquat, gibberellin, simazine, dimexano, dimethaclo, dimidazon, dimethametryn, dimethenamid, simetryn, simeton, dimepiperate, dimefuron, cinmetylin, swep, sulglycapin, sulcotrione, sulfallate, sulfentrazone, sulfosulfuron, sulfometuron, sulfometuron-metyl, sebumeton, sethoxydim, sebuthylazine, terbacil, daimuron, dazomet, dalapon, thiazafluron, thiazopyr, thiencarbazone, thiencarbazone-metyl, tiocarbazil, tioclorim, thiobencarb, thidiazimin, thidiazuron, thifensulfuron, thifensulfuron-metyl, desmedipham, desmetryn, tetrafluron, thenylclo, tebutam, tebuthiuron, terbumeton, tepraloxym, tefuryltrione, tembotrione, delaclo, terbacil, terbucarb, terbuclo, terbuthylazine, terbutryn, topramezone, tralkoxydim, triaziflam, triasulfuron, tri-allate, trietazine, tricamba, triclopyr, tridiphane, tritac, tritosulfuron, triflusulfuron, triflusulfuron-metyl, trifluralin, trifloxysulfuron, tripropindan, tribenuron-metyl, tribenuron, trifop, trifopsime, trimeturon, naptalam, naproanilide, napropamide, nicosulfuron, nitralin, nitrofen, nitrofluorfen, nipyraclufen, neburon, norflurazon, noruron, barban, paclobutrazol, paraquat, parafluron, haloxydine, haloxyfop, haloxyfop-P, haloxyfop-metyl, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metyl, picloram, picolinafen, bixyclopyrone, bispyribac, bispyribac-sodium, pydanon, pinoxaden, bifenox, piperophos, hymexazol, pyraclonil, pyrasulfotole, pyrazoxyfen, pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-etyll, pyrazolate, bilanafos, pyraflufen-etyll, pyriclor, pyridafol, pyriothobac, pyriothobac-sodium, pyridate, pyrifthalid, pyributicarb, pyribenzoxim, pyrimisulfan, primisulfuron, pyriminobac-metyl, pyroxasulfone, pyroxsulam, fenasulam, phenisopham, fenuron, fenoxasulfone, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etyll, phenothiol, fenoprop, phenobenzuron, fenthiaaprop, fenteracol, fentrazamide, phenmedipham, phenmedipham-etyll, butaclo, butafenacil, butamifos, buthiuron, buthidazole, butylate, buturon, butenaclo, butroxydim, butralin, flazasulfuron, flamprop, furyloxyfen, prynaclo, primisulfuron-metyl, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butyl, fluazolate, fluroxypyr, fluothiuron, fluometuron, fluoroglycofen, flurocoidone, fluorodifen, fluoronitrofen, fluoromidine, flucarbazone, flucarbazone-sodium, flucloalin, flucetosulfuron, fluthiacet, fluthiacet-metyl,

flupyrsulfuron, flufenacet, flufenican, flufenpyr, flupropacil, flupropanate, flupoxam, flumioxazin, flumiclorac, flumiclorac-pentyl, flumipropyn, flumezin, fluometuron, flumetsulam, fluridone, flurtamone, fluroxypyr, pretilaclo, proxan, proglinazine, procyazine, prodiamine, prosulfalin, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclo, propazine, propanil, propyzamide, propisoclo, prohydrojasmon, propyrisulfuron, propham, profluazol, profluralin, prohexadione-calcium, propoxycarbazone, propoxycarbazone-sodium, profoxydim, bromacil, brompyrazon, prometryn, prometon, bromoxynil, bromofenoxim, bromobutide, bromobonil, florasulam, hexacloacetone, hexazinone, pethoxamid, benazolin, penoxsulam, pebulate, beflubutamid, vernolate, perfluidone, bencarbazone, benzadox, benzipram, benzylaminopurine, benzthiazuron, benzfendizone, bensulide, bensulfuron-metyl, benzoylprop, benzobixyclon, benzofenap, benzofluor, bentazone, pentanoclo, benthiocarb, pendimethalin, pentoxazone, benfluralin, benfuresate, fosamine, fomesafen, foramsulfuron, forclofenuron, maleic hydrazit, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfuron, mesosulfuron-metyl, mesotrione, mesoprazine, methoprottryne, metazaclo, methazole, metazosulfuron, methabenzthiazuron, metamitron, metamifop, metam, methalpropalin, methiuron, methiozolin, methiobencarb, metyldymron, metoxuron, metosulam, metsulfuron, metsulfuron-metyl, metflurazon, metobromuron, metobenzuron, methometon, metolaclo, metribuzin, mepiquat-cloide, mefenacet, mefluidide, monalide, monisouron, monuron, monocloacetic acid, monolinuron, molinate, morfamquat, iodosulfuron, iodosulfuron-metyl-sodium, iodobonil, iodomethane, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenacil, rhodethanil, canxi peroxit và metyl bromua.

Thuốc trừ sâu sinh học điển hình được sử dụng cho các mục đích tương tự như trên bao gồm các công thức virus như virus gây bệnh đa bội thể (NPV), virus gây bệnh hạt (GV), virus đa hạt tế bào chất (CPV) và virus entomopox (EPV); thuốc trừ sâu vi sinh được sử dụng như một loại thuốc trừ sâu hoặc thuốc trừ sâu, chẳng hạn như *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* và *Pasteuria penetrans*; thuốc trừ sâu vi sinh được sử dụng như chất diệt vi khuẩn, chẳng hạn như *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, ngon lành *Erwinia carotovora* và *Bacillus subtilis*; và thuốc trừ sâu sinh học được sử dụng như chất diệt

cỏ, chẳng hạn như *Xanthomonas campestris*. Việc sử dụng kết hợp thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế với thuốc trừ sâu sinh học nói trên dưới dạng hỗn hợp có thể mang lại hiệu quả tương tự như trên.

Các ví dụ khác về thuốc trừ sâu sinh học được sử dụng kết hợp với Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt theo sáng chế bao gồm các động vật ăn thịt tự nhiên như *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Rệp sáp aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* và *Orius sauteri*; thuốc trừ sâu vi sinh như *Beauveria brongniartii*; và pheromon như (Z)-10-tetradecenyl axetat, (E, Z)-4,10-tetradecadienyl axetat, (Z)-8-dodecenyl axetat, (Z)-11-tetradecenyl axetat, (Z)-13-icosen-10-one và 14-metyl-1-octadecen.

Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1) của sáng chế hoặc muối của chúng cũng thích hợp để khử trùng các ký sinh trùng sống trong hoặc ngoài của động vật như người, vật nuôi và vật nuôi trong nhà. Động vật có thể là động vật không phải con người.

Sáng chế cũng bao gồm chất phòng trừ ngoại ký sinh ở động vật hoặc nội ký sinh bao gồm hợp chất theo sáng chế hoặc muối của chúng làm thành phần hoạt tính; và một phương pháp để kiểm soát ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh của động vật, bao gồm việc xử lý ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh ở động vật bằng chất kiểm soát ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh của động vật. Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng bằng cách bôi tại chỗ hoặc bôi trực tiếp thường lên một vị trí hoặc hai vị trí trên da của động vật như mèo hoặc chó. Diện tích ứng dụng thường từ 5 đến 10 cm². Sau khi được áp dụng, hợp chất theo sáng chế tốt nhất là khuếch tán khắp cơ thể động vật và sau đó khô mà không kết tinh hoặc thay đổi về hình dạng hoặc kết cấu trực quan. Lượng hợp chất được sử dụng nằm trong khoảng từ 0,1 đến 10 mL, tùy thuộc vào trọng lượng của con vật. Đặc biệt, lượng hợp chất được sử dụng tốt nhất là khoảng 0,5 đến 1 mL cho mèo và khoảng 0,3 đến 3 mL cho chó.

Chất phòng trừ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh vật theo sáng chế có hiệu quả chống lại, ví dụ, các ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh động vật sau đây. Ký sinh trùng Siphonaptera bao gồm các loài thuộc chi *Pulex* như *Pulex irritans*; các loài của chi *Ctenocephalides* như *Ctenocephalides felis* và *Ctenocephalides canis*; các loài của chi *Xenopsylla* như *Xenopsylla cheopis*; các loài của chi *Tunga* như *Tunga penetrans*; các

loài của chi *Echidnophaga* như *Echidnophaga gallinax*; và các loài của chi *Nosopsyllus* như *Nosopsyllus fasciatus*.

Ký sinh trùng Siphunculata bao gồm các loài thuộc chi *Pediculus* như *Pediculus humanus capitis*; các loài của chi *Pthirus* như *Pthirus pubis*; các loài của chi *Haematopinus* như *Haematopinus eurysternus* và *Haematopinus suis*; các loài của chi *Damalinia* như *Damalinia ovis* và *Damalinia bovis*; các loài của chi *Linognathus* như *Linognathus vituli* và *Linognathus ovillus* (ký sinh trên thân cừu); và các loài của chi *Solenopotes* như *Solenopotes capillatus*.

Ký sinh trùng Mallophaga bao gồm các loài thuộc chi *Menopon* như *Menopon gallinae*; *Trimenopon* spp.; *Trinoton* spp.; các loài của chi *Trichodectes* như *Trichodectes canis*; các loài của chi *Felicola* như *Felicola subrostratus*; các loài của chi *Bovicola* như *Bovicola bovis*; các loài của chi *Menacanthus* như *Menacanthus stramineus*; *Werneckiella* spp.; và *Lepikentron* spp.

Ký sinh trùng Hemiptera bao gồm các loài thuộc chi *Cimex* như *Cimex lectularius* và *Cimex hemipterus*; các loài của chi *Reduvius* như *Reduvius senilis*; các loài của chi *Arilus* như *Arilus cristatus*; các loài của chi *Rhodnius* như *Rhodnius prolixus*; các loài của chi *Triatoma* như *Triatoma rubrofasciata*; và *Panstrongylus* spp.

Ký sinh trùng Acarina bao gồm các loài thuộc chi *Amblyomma* như *Amblyomma americanum* và *Amblyomma maculatum*; các loài của chi *Boophilus* như *Boophilus miclus* và *Boophilus annulatus*; các loài của chi *Dermacentor* như *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor taiwanensis* và *Dermacentor andersoni*; các loài của chi *Haemaphysalis* như *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava* và *Haemaphysalis campanulata*; các loài của chi *Ixodes* như *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes pacificus* và *Ixodes holoxylus*; các loài của chi *Rhipicephalus* như *Rhipicephalus sanguineus* và *Rhipicephalus appendiculatus*; các loài của chi *Argas* như *Argas persicus*; các loài của chi *Ornithodoros* như *Ornithodoros hermsi* và *Ornithodoros turicata*; các loài của chi *Psoroptes* như *Psoroptes ovis* và *Psoroptes equi*; các loài của chi *Knemidocoptes* như *Knemidocoptes mutans*; các loài của chi *Notoedres* như *Notoedres cati* và *Notoedres muris*; các loài của chi *Sarcoptes* như *Sarcoptes scabiei*; các loài của chi *Otodectes* như *Otodectes cynotis*; các loài của chi *Listrophorus* như *Listrophorus vbbus*; *Chorioptes* spp.; *Hypodectes* spp.;

Pterolichus spp.; *xytodites* spp.; *Laminosioptes* spp.; các loài của chi *Dermanyssus* như *Dermanyssus gallinae*; các loài của chi *Ornithonyssus* như *Ornithonyssus sylviarum* và *Ornithonyssus bacoti*; các loài của chi *Varroa* như *Varroa jacobsoni*; các loài của chi *Cheyletiella* như *Cheyletiella yasguri* và *Cheyletiella blakei*; *Ornithocheyletia* spp.; các loài của chi *Demodex* như *Demodex canis* và *Demodex cati*; *Myobia* spp.; *Psorergates* spp.; và các loài của chi *Trombicula* như *Trombicula akamushi*, *Trombicula pallida* và *Trombicula scutellaris*. Ưu tiên là ký sinh trùng Siphonaptera, ký sinh trùng Siphunculata và ký sinh trùng Acarina.

Các động vật mà chất phòng trừ ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh theo sáng chế có thể được dùng có thể là động vật ký sinh đối với các ngoại ký sinh hoặc nội ký sinh động vật nói trên. Các động vật như vậy thường là loài thuần nhiệt và poikilotherms được nuôi làm vật nuôi hoặc vật nuôi trong nhà. Các loài hằng nhiệt máu nóng như vậy bao gồm các loài động vật có vú như gia súc, trâu, cừu, dê, lợn, lạc đà, hươu, nai, tuần lộc, ngựa, lừa, chó, mèo, thỏ, chồn, chuột, chuột đồng, sóc và khỉ; động vật mang lông như chồn, chinchillas và gấu trúc; và các loài chim như gà, ngỗng, gà tây, vịt nhà, chim bồ câu, vẹt và chim cú. Các loài động vật biến nhiệt nói trên bao gồm các loài bò sát như rùa cạn, rùa biển, trăn, rắn, rắn hổ mang. Ưu tiên là các loài hằng nhiệt máu nóng và ưu tiên hơn là các loài động vật có vú như chó, mèo, gia súc, ngựa, lợn, cừu và dê.

Vì chất phòng trừ theo sáng chế không có khả năng gây thiệt hại hoặc tác động đến động vật ăn thịt tự nhiên và côn trùng có ích (sau đây còn được gọi là sinh vật không mục tiêu), hai hoặc nhiều phương pháp kiểm soát côn trùng gây hại, v.v. có thể được kết hợp một cách hợp lý để sử dụng.

Ví dụ về sinh vật không mục tiêu bao gồm các loài săn mồi tự nhiên như *Phytoseiulus persimilis*, *Neoseiulus californicus*, *Amblyseius swirskii* Athias-Henriot, *Neoseiulus womersleyi*, và *Typhlodromus vulgaris*; và côn trùng có ích như ong mật, ong mật tây (*Apis mellifera*), ong vò vẽ, ong vò vẽ đuôi trâu (*Bombus terrestris*), ong mật có sừng (*Osmia cornifrons*), và bướm lụa trong nước (*Bombyx mori*).

Sau đây, các ví dụ sản xuất của các hợp chất biểu diễn theo sáng chế và các chất trung gian của chúng sẽ được mô tả chi tiết hơn, nhưng sáng chế không chỉ giới hạn trong các ví dụ này.

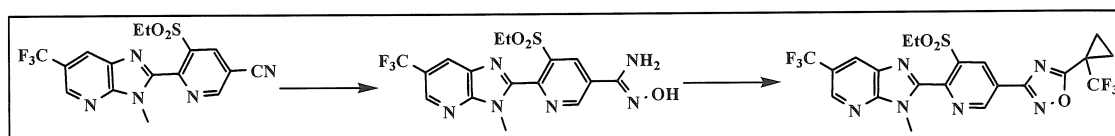
Ví dụ thực hiện sáng chế**Ví dụ sản xuất 1**

Sản

phẩm

3-(5-ethylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-5-(1-triflometylxcyclopropyl)-1,2,4-oxadiazol (Hợp chất số 1-14)

Công thức hóa học 5



5-ethylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)nicotinoni tril (1.00 g) được hòa tan trong etanol (10 mL), và trietylamin (0.71 mL) và hydroxylamin hydroclorua (0.26 g) được bổ sung. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 80°C trong thời gian 1 giờ. Nước được bổ sung, và chiết xuất etyl axetat được thực hiện. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không để tạo ra 5-(etylulfonyl)-N'-hydroxy-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-carboxamidin. Sản phẩm này được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế.

0.15 g sản phẩm thô thu được được hòa tan trong THF (tetrahydrofuran, 3 mL), và trietylamin (0.10 g) và 1-(triflometyl)xcyclopropanecarbonyl clorua (0.067 g) được bổ sung. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong thời gian 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc trong chân không. Phần dư được hòa tan trong axit axetic (1 mL), và sau đó dung dịch axit axetic được hòa tan trong toluen (2 mL). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 120°C trong thời gian 1 giờ. Thêm dung dịch natri cacbonat bão hòa chứa nước và tiến hành chiết etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magie sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm mong muốn (0,056 g, 30%).

Đặc tính vật lý: Điểm nóng chảy: từ 151 đến 152°C

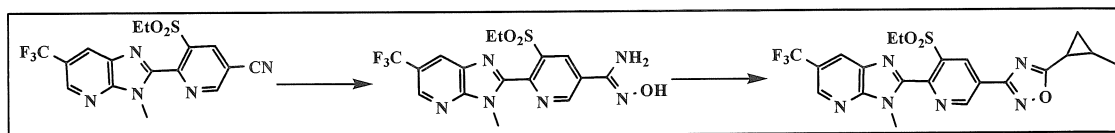
Ví dụ sản xuất 2

Sản

phẩm

3-(5-ethylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-5-(2-metylxcyclopropyl)-1,2,4-oxadiazol (Hợp chất số 1-6)

Công thức hóa học 6



5-ethylsulfonyl-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)nicotinonitril (1.00 g) được hòa tan trong etanol (10 mL), và trietylamin (0.71 mL) và hydroxylamin hydroclorua (0.26 g) được bổ sung. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 80°C trong thời gian 1 giờ. Nước được bổ sung, và chiết xuất etyl axetat được thực hiện. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không để tạo ra 5-ethylsulfonyl-N'-hydroxy-6-(3-metyl-6-triflometyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-2-yl)pyridin-3-carboxamidin. Sản phẩm này được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế.

0,15 g sản phẩm thô thu được được hòa tan trong THF (3 mL), và trietylamin (0,10 g) và 2-metylxcyclopropan-1-cacbonyl clorua (0,046 g) được thêm vào. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong thời gian 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc trong chân không. Phần dư được hòa tan trong axit axetic (1 mL), và sau đó dung dịch axit axetic được hòa tan trong toluen (2 mL). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 120°C trong thời gian 1 giờ. Thêm dung dịch natri cacbonat bão hòa chứa nước và tiến hành chiết etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magie sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm mong muốn (0,058 g, 34%).

Đặc tính vật lý: Điểm nóng chảy: từ 150 đến 151°C

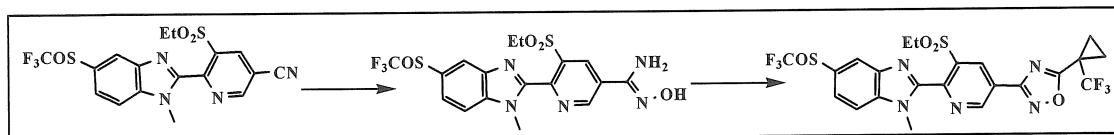
Ví dụ sản xuất 3

Sản

phẩm

3-(5-ethylsulfonyl-6-(1-metyl-5-triflometylsulfinyl)-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)pyridin-3-yl)-5-(1-triflometylxcyclopropyl)-1,2,4-oxadiazol (Hợp chất số 1-8)

Công thức hóa học 7



5-ethylsulfonyl-6-(1-metyl-5-triflometylsulfinyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)nicotinonitril (0.51 g) được hòa tan trong ethanol (10 mL), và trietylamin (0.32 mL) và hydroxylamin hydroclorua (0.12 g) được bổ sung. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 80°C trong thời gian 1 giờ. Nước được bổ sung, và chiết xuất etyl axetat được thực hiện. Lớp hữu cơ được làm khô qua natri sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không để tạo ra

5-ethylsulfonyl-N'-hydroxy-6-(1-metyl-5-triflometylsulfinyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)pyridin-3-carboxamidin. Sản phẩm này được sử dụng trong phản ứng tiếp theo mà không cần tinh chế.

0,15 g sản phẩm thô thu được được hòa tan trong THF (3 mL), và trietylamin (0,10 g) và 1-(triflometyl)xyclopropanecarbonyl clorua (0,067 g) được bổ sung. Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ phòng trong thời gian 1 giờ. Hỗn hợp phản ứng được cô đặc trong chân không. Phần dư được hòa tan trong axit axetic (1 mL), và sau đó dung dịch axit axetic được hòa tan trong toluen (2 mL). Hỗn hợp được khuấy ở nhiệt độ 120°C trong thời gian 1 giờ. Thêm dung dịch natri cacbonat bão hòa chứa nước và tiến hành chiết etyl axetat. Lớp hữu cơ được làm khô qua magie sulfat khan và sau đó được cô đặc trong chân không. Sản phẩm thô thu được được tinh chế bằng sắc ký cột để thu được sản phẩm mong muốn (0,090 g, 48%).

Đặc tính vật lý: Điểm nóng chảy: từ 140 đến 141°C

Sau đây, các ví dụ về công thức được thể hiện, nhưng sáng chế này không bị giới hạn ở đó. Trong các ví dụ bào chế, "phần" có nghĩa là một phần theo trọng lượng.

Ví dụ bào chế 1

Hợp chất theo sáng chế	10 phần
Xilen	70 phần
N-metylpyrrolidon	10 phần
Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi alkylbenzen sulfonat (tỷ lệ trọng lượng 1:1)	10 phần

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dạng bào chế cô đặc

có thể nhũ hóa.

Ví dụ bào chế 2

Hợp chất theo sáng chế	3 phần
Bột đất sét	82 phần
Bột diatomit	15 phần

Các thành phần trên được trộn đều và sau đó được nghiền thành bột để tạo ra dạng bào chế dạng bụi.

Ví dụ bào chế 3

Hợp chất theo sáng chế	5 phần
Hỗn hợp bột bentonit và bột đất sét	90 phần
Canxi lignosulfonat	5 phần

Các thành phần trên đã được trộn đều. Sau khi thêm lượng nước thích hợp, hỗn hợp được nhào, tạo hạt và làm khô để tạo ra dạng bào chế dạng hạt.

Ví dụ bào chế 4

Hợp chất theo sáng chế	20 phần
Cao lanh và axit silicic phân tán cao tổng hợp	75 phần
Hỗn hợp polyoxyetylen nonylphenyl ete và canxi alkylbenzen sulfonat (tỷ lệ trọng lượng 1:1)	5 phần

Các thành phần trên được trộn đều và sau đó nghiền thành bột để tạo ra dạng bào chế dạng bột có thể ướt.

Ví dụ bào chế 5

Hợp chất theo sáng chế	20 phần
Polyoxyetylen lauryl ete	3 phần
Natri dioctyl sulfosuccinat	3,5 phần
Dimetyl sulfoxit	37 phần
2-Propanol	36,5 phần

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra chế phẩm lỏng hòa tan trong nước.

Ví dụ bào chế 6

Hợp chất theo sáng chế	2 phần
Dimetyl sulfoxit	10 phần

2-Propanol	35 phần
------------	---------

Axeton	53 phần
--------	---------

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dung dịch để phun.

Ví dụ bào chế 7

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

Hexylen glycol	50 phần
----------------	---------

Isopropanol	45 phần
-------------	---------

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dung dịch để sử dụng qua da.

Ví dụ bào chế 8

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

Propylen glycol monometyl ete	50 phần
-------------------------------	---------

Dipropylen glycol	45 phần
-------------------	---------

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dung dịch để sử dụng qua da.

Ví dụ bào chế 9

Hợp chất theo sáng chế	2 phần
------------------------	--------

Parafin lỏng nhẹ	98 phần
------------------	---------

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dung dịch để sử dụng qua da (bôi lên). Ví dụ bào chế 10

Hợp chất theo sáng chế	2 phần
------------------------	--------

Parafin lỏng nhẹ	58 phần
------------------	---------

Dầu ô liu	30 phần
-----------	---------

Axit béo chuỗi triglyxerit chuỗi trung bình (ODO-H: được sản xuất bởi Nisshin OilliO Group, Ltd.)	9 phần
---	--------

Chất khử bọt gốc silic (tên thương mại: Shin-etsu silic, do Shin-Etsu Chemical Co., Ltd. sản xuất)	1 phần
--	--------

Các thành phần trên được trộn đồng nhất để hòa tan để tạo ra dung dịch để sử dụng qua da (bôi lên).

Các ví dụ thử nghiệm liên quan đến sáng chế được trình bày dưới đây, nhưng sáng chế không bị giới hạn ở đó.

Ví dụ thử nghiệm 1

Kiểm tra hiệu quả kiểm soát trên *Myzus persicae*

Cây cải thảo trồng trong chậu nhựa (đường kính 8 cm, cao 8 cm), Rệp đào xanh (*M. persicae*) đã được nhân giống trên cây, và số lượng rệp đào Xanh còn sống sót trong mỗi chậu được đếm. Các hợp chất có công thức chung (1) theo sáng chế được bào chế riêng theo Ví dụ bào chế 1, phân tán trong nước, và được pha loãng đến 500 ppm. Các chất phân tán hóa chất nông nghiệp được áp dụng cho các tán lá của cây bắp cải Trung Quốc trong chậu. Sau khi cây được làm khô bằng không khí, các chậu được giữ trong nhà kính. Tại thời điểm 6 ngày sau khi bón lá, số lượng rệp xanh còn sót lại trên cây bắp cải Trung Quốc trong mỗi chậu được đếm, tỷ lệ phòng trừ được tính theo công thức dưới đây và hiệu quả phòng trừ được đánh giá theo các chỉ tiêu dưới đây.

Công thức toán học 1]

$$\text{Tỷ lệ kiểm soát} = 100 - \{(T \square Ca)/(Ta \square C)\} \square 100$$

Ta: số cây sống sót trước khi bón lá trong lô xử lý

T: số cây sống sót sau khi bón lá trong lô xử lý

Ca: số cây sống sót trước khi bón lá trong lô không xử lý

C: số cây sống sót sau khi bón lá trong lô không xử lý

Tiêu chuẩn

A: tỷ lệ kiểm soát là 100%.

B: tỷ lệ kiểm soát là 90 đến 99%.

C: tỷ lệ kiểm soát là 80 đến 89%.

D: tỷ lệ kiểm soát là 50 đến 79%.

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7 và 1-8 theo sáng chế cho thấy mức hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 2

Thử nghiệm trừ sâu trên *Laodelphax striatellus*

Các hợp chất có công thức chung (1) theo sáng chế được bào chế riêng theo Ví dụ bào chế 1, phân tán trong nước, và được pha loãng đến 500 ppm. Cây lúa giống (giống: Nihonbare) được nhúng vào chất phân tán hóa chất nông nghiệp trong 30 giây. Sau khi làm khô bằng không khí, mỗi cây con được đưa vào một ống nghiệm thủy tinh riêng biệt và cấy 10 ấu trùng lúa 3 của *L. striatellus*, và sau đó các ống nghiệm thủy

tính được đây bằng nút bông. Tại thời điểm 8 ngày sau khi cấy, số lượng ấu trùng sống sót và ấu trùng chết được đếm, tỷ lệ chết đã hiệu chỉnh được tính theo công thức dưới đây, và hiệu quả diệt côn trùng được đánh giá theo tiêu chuẩn của Ví dụ thử nghiệm 1.

Công thức toán học 2]

Tỷ lệ tử vong đã sửa (%) = $100 \times (\text{Tỷ lệ sống trong lô không xử lý} - \text{Tỷ lệ sống trong lô xử lý}) / \text{Tỷ lệ sống trong lô không xử lý}$

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7 và 1-8 theo sáng chế cho thấy mức hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 3

Thử nghiệm trừ sâu trên *Plutella xylostella*

Loại trưởng thành của *P. xylostella* được thả vào cây giống bắp cải Trung Quốc và được phép đẻ trứng trên đó. Vào thời điểm 2 ngày sau khi thả con trưởng thành, cây con bắp cải Trung Quốc có trứng đã đẻ được nhúng trong khoảng 30 giây trong các công thức hóa chất nông nghiệp được pha loãng đến 500 ppm, mỗi công thức được điều chế theo Ví dụ bào chế 1 và chứa hợp chất khác có công thức chung (1) theo sáng chế làm thành phần hoạt tính. Sau khi làm khô bằng không khí, cây con được giữ trong buồng điều nhiệt ở 25°C. Tại thời điểm 6 ngày sau khi xử lý nhúng, số lượng ấu trùng nở trên mỗi ô được tính, tỷ lệ chết được tính theo công thức hiển thị dưới đây và hiệu quả diệt côn trùng được đánh giá theo các tiêu chí của Ví dụ thử nghiệm 1. Thử nghiệm này được thực hiện ba lần với 10 loại trưởng thành của *P. xylostella* trên mỗi lô.

Công thức toán học 3]

Tỷ lệ tử vong đã sửa (%) = $100 \times (\text{Số ấu trùng nở trong lô không xử lý} - \text{Số ấu trùng nở trong lô xử lý}) / \text{Số ấu trùng nở trong lô không xử lý}$

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7 và 1-8 theo sáng chế cho thấy mức hoạt tính được đánh giá là A.

Ví dụ thử nghiệm 4

Phân tích nhu động của ấu trùng trên *Haemonchus contortus*

Các dung dịch pha loãng DMSO của các hợp chất khác nhau theo sáng chế được thêm ở nồng độ cuối cùng là 50 ppm vào các giếng của đĩa có 96 đĩa chứa môi trường điều kiện được xác định trước. Hai mươi ấu trùng giai đoạn L1 của *H. contortus* đã

được đưa vào từng giếng của đĩa 96 giếng. Đĩa được để trong 4 ngày, và sau đó kiểm tra nhu động của ấu trùng. Phần trăm ức chế nhu động trong các giếng của mỗi bước xử lý được tính toán so với các giếng khi xử lý chỉ với DMSO.

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, và 1-7 theo sáng chế cho thấy phần trăm ức chế nhu động từ 50% hoặc lớn hơn.

Ví dụ thử nghiệm 5

Phân tích khả năng nhu động của ấu trùng trên *Dirofilaria Immitis*

Năm trăm ấu trùng giai đoạn L1 của *D. immitis* được pha loãng trong môi trường điều kiện được xác định trước và đưa vào mỗi giếng của đĩa 96 giếng. Các dung dịch pha loãng DMSO của các hợp chất khác nhau theo sáng chế được thêm vào ở nồng độ cuối cùng là 50 ppm vào các giếng của đĩa 96 giếng. Đĩa được để trong 3 ngày, và sau đó kiểm tra nhu động của ấu trùng. Phần trăm ức chế nhu động trong các giếng của mỗi bước xử lý được tính toán so với các giếng khi xử lý chỉ với DMSO.

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4, 1-5, 1-6, và 1-7 theo sáng chế cho thấy phần trăm ức chế nhu động từ 50% hoặc lớn hơn.

Ví dụ thử nghiệm 6

Phân tích hoạt tính diệt ký sinh trùng qua đường miệng đối với loài trưởng thành *Ctenocephalides felis*

Loài trưởng thành mới xuất hiện của *C. felis* được đặt vào lồng thử nghiệm (10 con trưởng thành trên mỗi lồng thử nghiệm). Các dung dịch pha loãng DMSO của các hợp chất khác nhau theo sáng chế đã được thêm vào lượng lớn máu bò ở nồng độ cuối cùng là 50 ppm và được dùng bằng miệng cho loài trưởng thành *C. felis* bằng cách sử dụng bộ nạp. Tỷ lệ tử vong được kiểm tra vào ngày hôm sau. Các loài trưởng thành Aberrant được coi như đã chết.

Kết quả là, các hợp chất 1-2, 1-4 và 1-7 theo sáng chế cho thấy hoạt tính diệt ký sinh trùng với tỷ lệ tử vong là 50% hoặc lớn hơn.

Ví dụ thử nghiệm 7

Phân tích hoạt tính diệt ký sinh trùng qua da đối với nhộng của *Rhipicephalus sanguineus*

Các dung dịch pha loãng DMSO của các hợp chất khác nhau theo sáng chế được pha loãng riêng lẻ đến nồng độ cuối cùng là 100 ppm bằng hỗn hợp axeton/triton và

được áp dụng vào bên trong các lọ mẫu có lỗ thông hơi. Sau khi làm khô qua đêm, mười nhộng của *R. sanguineus* được đưa vào mỗi lọ, và tỷ lệ tử vong được kiểm tra hai ngày sau đó. Các loài trưởng thành Aberrant được coi như đã chết.

Kết quả là, các hợp chất 1-4 và 1-5 theo sáng chế cho thấy hoạt tính diệt ký sinh trùng với tỷ lệ tử vong từ 50% hoặc lớn hơn.

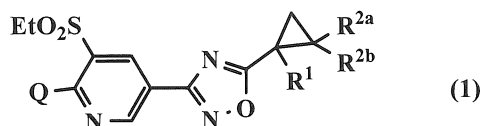
Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Hợp chất theo sáng chế có hiệu quả cao trong việc phòng trừ phạm vi rộng các loài gây hại nông nghiệp hoặc trồng trọt cũng như nội sinh vật và ngoại ký sinh động vật và do đó rất hữu ích.

YÊU CẦU BẢO HỘ

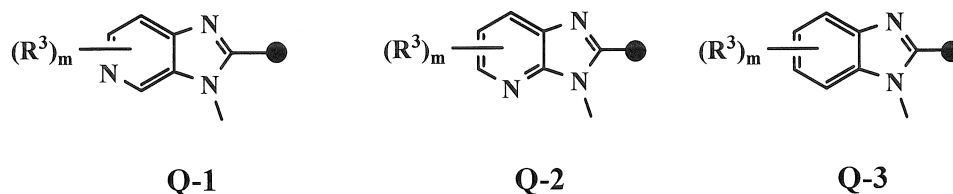
1. Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể được biểu diễn bởi công thức chung (1):

công thức hóa học 1



(trong đó R^1 , R^{2a} , và R^{2b} có thể giống nhau hoặc khác nhau và mỗi loại biểu diễn (a1) nguyên tử hydro; (a2) nguyên tử halogen; (a3) nhóm xyano; (a4) nhóm (C_1 - C_6) alkyl; (a5) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; hoặc (a6) nhóm phenyl, với điều kiện là R^1 , R^{2a} , và R^{2b} không phải là tất cả nguyên tử hydro, Et là nhóm etyl, và Q là nhóm bất kỳ trong số các nhóm được biểu diễn bởi từ Q-1 đến Q-3 sau đây:

Công thức hóa học 2



trong đó R^3 là (b1) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; (b2) nhóm halo (C_1 - C_6) alkoxy; (b3) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylthio; (b4) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfinyl; hoặc (b5) nhóm halo (C_1 - C_6) alkylsulfonyl, mỗi vòng được tô đặc màu đen là vị trí liên kết, và m là 1 hoặc 2), hoặc muối của chúng.

2. Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm 1, trong đó R^1 là (a4) nhóm (C_1 - C_6) alkyl; (a5) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl; hoặc (a6) nhóm phenyl, R^{2a} và R^{2b} là (a1) các nguyên tử hydrogen, và R^3 là (b1) nhóm halo (C_1 - C_6) alkyl.

3. Hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm 1 hoặc 2, trong đó Q là Q-2.

4. Thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 làm thành phần hoạt tính.
5. Phương pháp để sử dụng thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp hoặc trồng trọt, bao gồm bước xử lý thực vật hoặc đất với lượng hữu hiệu hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3.
6. Chất phòng trừ vật ký sinh ngoài hoặc vật ký sinh ngoài động vật bao gồm hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3 làm thành phần hoạt tính.
7. Phương pháp để sử dụng chất phòng trừ vật ký sinh ngoài, bao gồm việc dùng cho động vật qua da lượng hữu hiệu hợp chất dị vòng ngưng tụ có nhóm xyclopropan-oxadiazol được thể hoặc muối của chúng theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3.